# WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro



(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 261/04, 307/58, A01N 43/80, 43/08

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

WO 99/07688

**A1** (43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

18. Februar 1999 (18.02.99)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP98/04636

(22) Internationales Anmeldedatum:

23. Juli 1998 (23.07.98)

(30) Prioritätsdaten:

197 34 201.9

7. August 1997 (07.08.97)

DF

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AK-TIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ENGEL, Stefan [DE/DE]; Koelerstrasse 8, D-55286 Wörrstadt (DE), RHEIN-HEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Strasse 24, Ludwigshafen (DE). BAUMANN, Ernst [DE/DE]: Falkenstrasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE). von DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). HILL, Regina, Luise [DE/DE]; Ziegelofenweg 40, D-67346 Speyer (DE). MAYER, Guido [DE/DE]; Gutleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE). WAGNER, Oliver [DE/DE]; Rossinistrasse 7, D-67061 Ludwigshafen (DE). WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstrasse 81, D-67061 Ludwigshafen (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse

28, D-67069 Ludwigshafen (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]: Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, GE, HU, ID, IL, JP, KR, KZ, LT, LV, MK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, VN, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

#### Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Anderungen eintreffen.

- (54) Title: 2-BENZOYL-CYCLOHEXANE-1,3-DIONES
- (54) Bezeichnung: 2-BENZOYL-CYCLOHEXAN-1,3-DIONE
- (57) Abstract

The invention relates to substituted 2-benzoyl-cyclohexane-1,3-diones of formula (I), wherein the substituents have the following meaning: R1, R2 stand for hydrogen, mercapto, nitro, halogen, cyano, rhodanine,  $C_1$ - $C_6$ -alkyl,  $C_1$ - $C_6$  halogen alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -alkoxy,  $C_2$ - $C_6$ -alkenyl,  $C_2-C_6$ -alkinyl,  $-OR^3$ ,  $-OCOR^3$ ,  $-OSO_2R^3$ ,  $-S(O)_nR^3$ ,  $SO_2OR^3$ ,  $-NR^3SO_2R^3$  or  $-NR^3COR^3$ , wherein R<sup>3</sup> can have different meanings; n represents 0, 1 or 2; Q stands for an optionally sub-

stituted two-position bonded chyclohexane-1,3-dion ring; X1 stands for a straight-chain or branched C1-C6-alkylene, a C2-C6-alkenylene or a C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinylene chain, wherein the above-mentioned alkylene, alkenylene or alkinylene radicals can be partially halogenated and/or carry one to three of the following groups: -OR4, -OCOR4, -OCONHR4 or -OSO2R4; wherein R4 can have different meanings and the above-mentioned alkenylene radicals in which the double bond is located in the alpha, beta position with respect to the phenyle ring are excluded and in which Het is linked to the double bond in the beta position; Het represents a three to six-membered, partially or fully saturated heterocyclic group or a three to six-membered heteroaromatic group with up to three heteroaroms selected form the nitrogen, oxygen or sulfur group, wherein the above-mentioned heterocyclic or heteroaromatic group can be partially or totally halogenated and/or R<sup>5</sup> can be substituted; wherein R<sup>5</sup> can have different meanings. The invention further relates to the agricultural use of the salts of said compounds, to a method and to the intermediate products for the production of compounds of formula (I), to the agents contained in said compounds, to the use of the compounds of formula (I) and to the agents containing said compounds used in the control of harmful plants.

#### (57) Zusammenfassung

Die vorliegende Anmeldung betrifft Substituierte 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutung haben: R¹, R² Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, -OR³, -OCOR³, -OSO<sub>2</sub>R³, -SO<sub>2</sub>OR³, -SO<sub>2</sub>OR³, -SO<sub>2</sub>N(R³)<sub>2</sub>, -NR³SO<sub>2</sub>R³ oder -NR³COR³; worin R³ verschiedene Bedeutungen haben kann; n 0, 1 oder 2; Q ein gegebenenfalls substituierter, in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring; X¹ eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen-, eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylen- oder eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylenkette, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylenreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: -OR⁴, -OCOR⁴, -OCONHR⁴ oder -OSO<sub>2</sub>R⁴; worin R⁴ verschiedene Bedeutungen haben kann und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in alpha, beta-Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die beta-Position an die Doppelbindung gebunden ist; Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel, wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch R⁵ substituiert sein kann; worin R⁵ verschiedene Bedeutungen haben kann, sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze, Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I), Mittel, welche diese enthalten, sowie die Verwendung der Verbindungen der Formel (I) und diese enthaltende Mittel zur Schadpflanzenbekämpfung.

#### LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	I.S	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	L٧	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische	T.M	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland		Republik Mazedonien	TR	Türkei
BG	Buigarien	HU	Ungarn	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin -	ΙE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von
CA	Kanada	IT	Italien	MX	Mexiko		Amerika
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CG	Kongo	KE	Kenia	NL	Nicderlande	VN	Vietnam
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik	NZ	Neuseeland	zw	Zimbabwe
CM	Kamerun		Korea	PL	Polen		
CN	China	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CU	Kuba	ΚZ	Kasachstan	RO	Rumanien		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dänemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

WO 99/07688 PCT/EP98/04636

2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione

# Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I

10

15

$$Q = \begin{pmatrix} X^1 & \text{Het} \\ R^1 & R^2 \end{pmatrix}$$

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

20

Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,  $R^1$ ,  $R^2$  $C_1-C_6-Alkyl$ ,  $C_1-C_6-Halogenalkyl$ ,  $C_1-C_6-Alkoxy$ ,  $C_2-C_6-Alkenyl$ ,  $C_2-C_6-Alkinyl$ ,  $-OR^3$ ,  $-OCOR^3$ ,  $-OSO_2R^3$ ,  $-S(0)_{n}R^{3}$ ,  $-SO_{2}OR^{3}$ ,  $-SO_{2}N(R^{3})_{2}$ ,  $-NR^{3}SO_{2}R^{3}$  oder  $-NR^{3}COR^{3}$ ;

25

Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $\mathbb{R}^3$  $C_2-C_6-Alkenyl$ ,  $C_2-C_6-Alkinyl$ , Phenyl oder Phe $ny1-C_1-C_6-alkyl;$  wobei die genannten Alkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/ oder eine 30 bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R3, -OR3, -SR3, -N(R3)2,  $=NOR^3$ ,  $-OCOR^3$ ,  $-SCOR^3$ ,  $-NR^3COR^3$ ,  $-CO_2R^3$ ,  $-COSR^3$ ,  $-CON(R^3)_2$ , 35 carbonyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxy- $C_2-C_6$ -alkoxycarbonyl,  $C_1-C_4$ -Alkylsulfonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Phenyl, Benzyl, Hetarvl, Phenoxy, Benzyloxy und Hetaryloxy, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits substituiert sein können;

40

0, 1 oder 2;

45

n

ein gegebenenfalls substituierter, in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring;

eine geradkettige oder verzweigte C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylen-, eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylen- oder eine C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylenkette, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylenreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

-OR<sup>4</sup>, -OCOR<sup>4</sup>, -OCONHR<sup>4</sup> oder -OSO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>;

und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, 10 bei denen sich die Doppelbindung in  $\alpha,\beta$ -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die  $\beta$ -Position an die Doppelbindung gebunden ist;

Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl, phenyl, Phenyl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl oder Alkinylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/ oder durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl,  $C_1-C_4-\text{Alkylamino}, \ C_1-C_4-\text{Dialkylamino}, \ C_1-C_4-\text{Alkoxy-carbonyl}, \ C_1-C_4-\text{Alkylcarbonyl}, \ C_1-C_4-\text{Alkylcarbonyloxy}, \\ C_1-C_4-\text{Alkyl}, \ C_1-C_4-\text{Halogenalkyl}, \ C_1-C_4-\text{Alkylthio}, \\ C_1-C_4-\text{Halogenalkylthio}, \ C_1-C_4-\text{Alkoxy}, \ C_1-C_4-\text{Halogenalkoxy};$ 

Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

30

wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatische 35 Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch  $R^5$  substituiert sein kann;

Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro,
Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Dialkylamino,
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils
durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert
sein können:

WO 99/07688 PCT/EP98/04636

3

Cyano, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyloxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

- Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche diese enthalten, sowie die Verwendung der Verbindungen der Formel I und diese enthaltende Mittel zur Schadpflanzenbekämpfung.
- Aus der Literatur, beispielsweise aus EP-A 278 742, EP-A 298 680, EP-A 320 864 und WO 96/14285 sind 2-Benzoylcyclohexan-1,3-dione bekannt.
- Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen 20 sowie die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können jedoch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung die Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Verbindungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.
- 25 Demgemäß wurden die erfindungsgemäßen 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.
- Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Darüber hinaus wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I gefunden.
- Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Stereoisomere der Verbindungen der Formel I. Es werden sowohl reine Stereoisomere als auch Gemische hiervon erfaßt.
- 40 Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomerengemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren als auch deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

Es kommen als Kationen, insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C1-C4-Alkyl oder Hydroxy-C1-C4-alkyl und/oder ein Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C1-C4-alkyl)-sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C1-C4-alkyl)-sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat,

Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Hervorzuheben sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel 30 I, wobei die Variable Q einen in 2-Stellung verknüpften Cyclohexan-1,3-dionring der Formel II darstellt,

wobei II auch stellvertretend für die tautomeren Formeln II' und II" steht,

45

35

5 
$$R^{9}$$
  $R^{10}$   $R^{11}$   $R^{9}$   $R^{10}$   $R^{11}$   $R^{9}$   $R^{10}$   $R^{11}$   $R^{11}$   $R^{11}$   $R^{11}$ 

wobei

10

20

 $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^9$  und  $\mathbb{R}^{11}$  für Wasserstoff oder  $\mathbb{C}_1$ - $\mathbb{C}_4$ -Alkyl stehen;

 $R^8$  für Wasserstoff,  $C_1-C_4-Alkyl$  oder  $C_3-C_4-Cycloalkyl$  steht, wobei die beiden letztgenannten Gruppen einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können:

Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy;

oder

für Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dioxolan2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl oder 1,3-Dithian-2-yl
steht, wobei die 6 letztgenannten Reste durch ein bis
drei C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylreste substituiert sein können;

 $R^{10}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl steht;

oder

 $\mathbb{R}^8$  und  $\mathbb{R}^{11}$  gemeinsam eine  $\pi$ -Bindung oder einen drei- bis sechsgliedrigen carbocyclischen Ring bilden;

oder

die CR8R9-Einheit durch C=O ersetzt sein kann.

45

40

Verfahren A:

Umsetzungen von Cyclohexan-1,3-dion der Formel II mit einer aktivierten Carbonsäure IIIa oder einer Carbonsäure IIIb die vorzugsbeise in situ aktiviert wird, zu dem Acylierungsprodukt IV und anschließende Umlagerung zu den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I.

15

HO

HO

$$R^{1}$$
 $R^{2}$ 

Het

 $R^{1}$ 
 $R^{2}$ 

Het

 $R^{2}$ 
 $R^{3}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{5}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 

Het

 $R^{2}$ 
 $R^{3}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{2}$ 
 $R^{4}$ 
 $R^{4}$ 

WO 99/07688 PCT/EP98/04636

7

 $L^1$  steht für eine mucleophil austauschbare Abgangsgruppe, wie Halogen z. B. Brom, Chlor, Hetaryl, z. B. Imidazolyl, Pyridyl, Carboxylat, z. B. Acetat, Trifluoracetat etc.

Die aktivierte Carbonsäure kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Carbonsäurehalogenide oder in situ erzeugt werden, z. B. mit Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäureester, 2-Pyridindisulfit/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

10

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z. B. 1,2 bis 1,5 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder
20 Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z. B. chlorierte
Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether,
wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran,
Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril,
25 Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäureethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Carbonsäurehalogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reakti30 onspartners die Reaktionsmischung auf 0 - 10 °C abzukühlen. Anschließend rührt man bei 20 - 100 °C, vorzugsweise bei 25 - 50 °C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z. B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäureethylester. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels wird der rohe Enolester der Formel IV vorzugsweise durch Chromatographie gereinigt. Es ist aber auch möglich, den rohen Enolester der Formel IV ohne weitere Reinigung zur Umlagerung einzusetzen.

Die Umlagerung der Enolester der Formel IV zu den Verbindungen der Formel I erfolgt zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 40 °C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls in Gegenwart einer Cyanoverbindung.

Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

5

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin oder Alkalicarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt werden Triethylamin oder Alkalicarbonate verwendet.

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid, Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie

Acetoncyanhydrin, Trimethylsilycyanid in Betracht. Sie werden in
einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z. B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise 10
Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

20
Besonders bevorzugt werden Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, in Acetonitril oder Dioxan eingesetzt.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das

25 Reaktionsgemisch wird z. B. mit verdünnter Mineralsäure, wie
5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z. B. Methylenchlorid, Essigsäureethylester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5 - 10 %iger Alkalicarbonatlösung, z. B. Natriumcarbonat-, Kaliumcarbonatlösung sung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingeengt.

(Beispiele für die Darstellung von Estern von Hydroxypyrazolen  $^{35}$  und für die Umlagerung der Ester sind z. B. in EP-A 282 944 oder US 4 643 757 genannt).

Die Benzoesäuren der Formel III sind neu,

40

$$R^{12}$$
 $R^{1}$ 
 $R^{2}$ 
Het

wobei die Variablen folgende Bedeutung haben:

- R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $-OR^3$ ,  $-OCOR^3$ ,  $-OSO_2R^3$ ,  $-S(O)_nR^3$ ,  $-SO_2OR^3$ ,  $-SO_2N(R^3)_2$ ,  $-NR^3SO_2R^3$  oder  $-NR^3COR^3$ ;
- Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl, Phenyl oder Phenyl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl; wobei die genannten Alkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
- Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R³, -OR³, -SR³, -N(R³)₂, =NOR³, -OCOR³, -SCOR³, -NR³COR³, -CO₂R³, -COSR³, -CON(R³)₂, C¹-C⁴-Alkyliminooxy, C¹-C⁴-Alkoxyamino, C¹-C⁴-Alkyl-carbonyl, C¹-C⁴-Alkoxy-C²-C⁶-alkoxycarbonyl, C¹-C⁴-Alkyl-sulfonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Phenyl, Benzyl, Hetaryl, Phenoxy, Benzyloxy und Hetaryloxy, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits substituiert sein können;
  - n 0, 1 oder 2;

25  $X^1$  eine geradkettige oder verzweigte  $C_1$ - $C_6$ -Alkylen-, eine  $C_2$ - $C_6$ -Alkenylen- oder eine  $C_2$ - $C_6$ -Alkinylenkette, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

- -OR4, -OCOR4, -OCONHR4 oder -OSO2R4
- und wobei die genannten Alkylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in  $\alpha,\beta$ -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die  $\beta$ -Position an die Doppelbindung gebunden ist;
- Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl, Phenyl, Phenyl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl oder Alkinylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/ oder durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:
- 45 Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl,  $C_1-C_4-Alkylamino$ ,  $C_1-C_4-Dialkylamino$ ,  $C_1-C_4-Alkoxy-Dialkylamino$

WO 99/07688 PCT/EP98/04636

10

carbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyloxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy;

- eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:
- 10 Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

sein können:

wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch  $R^5$  substituiert sein kann;

- Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert
- $\label{eq:cyano} \mbox{Cyano, Formyl, $C_1-C_4-Alkylamino, $C_1-C_4-Dialkylamino,$} \\ \mbox{$C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $C_1-C_4-Alkylcarbonyl, $C_1-C_4-Alkyl-carbonyloxy, $C_1-C_4-Alkyl, $C_1-C_4-Halogenalkyl, $C_1-C_4-Alkyl-thio, $C_1-C_4-Halogenalkylthio, $C_1-C_4-Alkoxy, $C_1-C_4-Halogenalkylthio, $C_1-C_4-Alkylthio, $C_1-C_4$ 
  - R12 Hydroxy oder ein hydrolysierbarer Rest.
- 35 Beispiele für hydrolysierbare Reste sind Alkoxy-, Phenoxy-, Alkylthio-, Phenylthioreste, die substituiert sein können, Halogenide, Hetarylreste, die über Stickstoff gebunden sind, Amino-, Iminoreste, die substituiert sein können, etc.
- 40 Bevorzugt sind Benzoesäurehalogenide IIIa mit  $L^1$  = Halogen ( $\hat{}$  III mit  $R^{12}$  = Halogen),

15

20

10 wobei die Variablen  $R^1,\ R^2,\ X^1$  und Het die unter Formel III genannte Bedeutung haben und

L<sup>1</sup> Halogen, insbesondere Chlor oder Brom, bedeuten.

15 Ebenso bevorzugt sind Benzoesäuren der Formel IIIb ( $\ \ \ \$  III mit  $R^{12}=$  Hydroxy),

HO 
$$\mathbb{R}^1$$
  $\mathbb{R}^2$  IIIb

wobei die Variablen  $\mathbb{R}^1$ ,  $\mathbb{R}^2$ ,  $\mathbb{X}^1$  und Het die unter Formel III genannte Bedeutung haben.

30 Ebenso bevorzugt sind Benzoesäureester der Formel IIIc ( $\stackrel{\triangle}{=}$  III mit  $R^{12} = C_1 - C_6 - Alkoxy)$ ,

wobei die Variablen  $\mathbb{R}^1$ ,  $\mathbb{R}^2$ ,  $\mathbb{X}^1$  und Het die unter Formel III genaante Bedeutung haben und

 $M = C_1 - C_6 - Alkoxy$ 

bedeutet.

Die Verbindungen der Formel IIIa (mit L<sup>1</sup> = Halogen) können in Analogie zu literaturbekannten Methoden (vgl. L.G. Fieser, M. Fieser "Reagents for Organic Synthesis", Bd. I, S. 767-769 (1967)) durch Umsetzung von Benzoesäuren der Formel IIIb mit Halogenierungsreagentien wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosgen, Diphosgen, Oxalylchlorid, Oxalylbromid dargestellt werden.

Die Benzoesäuren der Formel IIIb können u. a. durch Verseifung der Benzoesäureester der Formel IIIc (mit  $M=C_1-C_6-Alkoxy$ ) erhalten werden.

Die erfindungsgemäßen Benzoesäureester der Formel IIIc sind nach verschiedenen literaturbekannten Methoden (z. B. a. G. Dittus in Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Band VI/3, Sauer-20 stoff-Verbindungen I, 4. Aufl., S. 493 ff., Georg Thieme Verlag, 1965; b. T. L. Gilchrist, Heterocyclenchemie, 2. Aufl., Verlag Chemie, 1995) darstellbar, wie in den nachfolgenden Beispielen illustriert.

### 25 Verfahren B:

40

Metallierung geeigneter Benzoesäureester IIIc in ortho-Position zur Esterfunktion mit starken, metallorganischen Basen und anschließende 1,2-Addition einer Carbonylverbindung V liefert die 30 erfindungsgemäßen Benzoesäureester IIIe,

wobei  $R^{13}$  einen zur *ortho-*Metallierung geeigneten Substituenten  $R^1$  darstellt (z.B. V. Snieckus, *Chem. Rev.*, 1990, 90, 879), bevorzugt Halogen und  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy und

45  $x^2$  eine geradkettige oder verzweigte  $C_1$ - $C_5$ -Alkylen-, eine  $C_2$ - $C_5$ -Alkenylen- oder eine  $C_2$ - $C_5$ -Alkinylenkette bedeutet, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylen-

reste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

-OR4, -OCOR4, -OCONHR4 oder -OSO2R4,

5

und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in  $\alpha, \beta$ -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die  $\beta$ -Position an die Doppelbindung gebunden ist.

10

Geeignete metallorganische Basen zur ortho-Metallierung der literaturbekannten Benzoesäureester IIId sind z.B. Alkyllithiumverbindungen, bevorzugt n-Butyllithium oder sec-Butyllithium, Lithiumdialkylamide, bevorzugt Lithiumdiisopropylamid oder 15 Natriumhexamethyldisilazid.

Als geeignete inerte Lösungsmittel kommen bei der direkten ortho-Metallierung z.B. Tetrahydrofuran, Diethylether, 1,2-Dimethoxyethan oder 1,4-Dioxan, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid,

20 Methyl-tert-butylether oder auch Mischungen dieser Lösungsmittel in Betracht.

Die Reaktionstemperaturen können von -80 bis 100°C, vorzugsweise von -80 bis 40°C betragen.

25

Die Umsetzung der in situ erzeugten, ortho-metallierten Benzoesäureester IIId mit den Aldehyden V werden bei Reaktionstemperaturen von -80 bis 100°C durchgeführt.

30 Die erfindungsgemäßen Produkte IIIe enthalten eine Hydroxymethylen-Gruppe, die sich für weitere Derivatisierungen nach literaturbekannten Methoden eignet. So kann die Hydroxymethylen-Gruppe z.B. zur Methoxy-Gruppe methyliert werden.

IIIe

IIIf

Verfahren C:

1,3-dipolare Cycloaddition der Benzoesäureester IIIg mit gegebenenfalls substituierten Olefinen oder Acetylenen unter
5 dehydratisierenden Bedingungen liefert die erfindungsgemäßen Benzoesäureester, wie beispielsweise IIIh.

15

Zur Dehydratisierung nach der Methode von Mukaiyama werden bevorzugt aromatische Isocyanate (z.B. T. Mukaiyama et al., J. Am. Chem. Soc. 1960, 82, 5339), wie z.B. Phenylisocyanat oder 4-Chlorphenylisocyanat eingesetzt.

20

In der Variante nach Shimizu eignen sich ebenfalls aliphatische Chlorameisensäureester (z.B. T. Shimizu et al., Bull. Chem. Soc. Jpn. 1986, 59, 2827), bevorzugt Ethylchloroformat.

25 Neuere Entwicklungen zeigen, daß z.B. auch N,N-Diethylaminoschwefeltrifluorid (DAST), (Methoxycarbonylsulfamoyl)-triethylammoniumhydroxid (Burgess Reagens), Phosphorylchlorid (z.B. C. Mioskowski et al., Tetrahedron Letters 1997, 38, 1547) oder auch eine Kombination aus Di-tert-butyl-dicarbonat (Boc<sub>2</sub>O) und 30 4-Dimethylaminopyridin (DMAP) (A. Hassner et al., Synthesis 1997, 309) erfolgreich als dehydratisierende Reagenzien zur Erzeugung von Nitriloxiden eingesetzt werden können.

Die auf diese Weise in situ gebildeten Nitriloxide können bei 35 Raumtemperatur bis zur Siedetemperatur des verwendeten Lösungsmittels mit beliebig substituierten Olefinen oder Acetylen zu den erfindungsgemäßen Benzoesäureestern IIIc umgesetzt werden, wobei hier beispielsweise X<sup>1</sup> eine Methylengruppe und Het einen gegebenenfalls substituiertes Isoxazol- oder Isoxazolingerüst 40 darstellt.

Die Durchführung der Cycloaddition erfolgt in inerten Lösungsmitteln, wie beispielsweise Toluol, Chloroform oder Acetonitril.

45 Der Benzoesäureester IIIg kann durch Reduktion nach literaturbekannten Methoden aus IIIj erhalten werden, der durch Nitroolefinierung (z.B. a. V. V. Perekalin et al., Nitroalkenes, John Wiley & Sons Ltd., New York 1994, b. A. G. M. Barrett et al., Chem. Rev. 1986, 86, 751) des entsprechenden Aldehyds IIIi hergestellt werden kann.

Nitro— Reduktion

Nitro— Reduktion

NO<sub>2</sub>

NO<sub>2</sub>

$$R^1$$
 $R^2$ 
 $R^2$ 

15  $_{
m Hervorzuheben}$  sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I, wobei die Gruppe  ${
m X}^1$  entweder für eine  $C_1$ - $C_2$ -Alkylen- oder eine  $C_2$ -Alkenylenkette steht und

eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

25 Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch  $\mathbb{R}^5$  substituiert sein kann,

darstellt.

30

Darüber hinaus sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I hervorzuheben, wobei die Gruppe Het für eine fünf- oder sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte heterocyclische oder eine fünf- oder sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel steht, wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert und/oder durch R<sup>5</sup> substituiert sein kann;

Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ - $C_$ 

alkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

Cyano, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyloxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy.

10

30

Die für die Substituenten R¹ - R¹³ oder als Reste an Phenyl-,
Hetaryl- und Heterocyclylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der
einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Cycloalkyl-, Alkoxyalkyl-,
Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkyliminooxy-, Alkoxyamino-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl, Alkylcarbonyl-, Halogenalkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl-, Alkoxyalkoxycarbonyl-, Alkenyl-,
Cycloalkenyl-, Alkinyl-Teile können geradkettig oder verzweigt
sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte
Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene
Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor,
Chlor, Brom oder Iod.

# 25 Ferner bedeuten beispielsweise:

- $C_1-C_4$ -Alkyl, sowie die Alkylteile von  $C_1-C_4$ -Alkylcarbonyl: Methyl, Ethyl, n-Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- $C_1$ - $C_6$ -Alkyl, sowie die Alkylteile von  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_6$ -alkyl und  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl:  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl,
- 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl,
  2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl,
  2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl
  und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
  - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z. B. Chlormethyl,
- Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,

- 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl,
  2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl,
  2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl,
  3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlor-
- 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl und Nonafluorbutyl;
- 10  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl, sowie die Halogenalkylteile von  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylcarbonyl:  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Dodecafluorhexyl;
- 20  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy, sowie die Alkoxyteile von  $C_1$ - $C_6$ -Alko-xy- $C_1$ - $C_6$ -alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy- $C_2$ - $C_6$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alko-xy- $C_2$ - $C_6$ -alkoxycarbonyl und  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl:  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methoxylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy,
- 25 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy,
  Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy,
  4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy,
  1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy,
  3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Tri-
- methylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methyl-propoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
  - $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy: einen  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z. B. Fluormethoxy,
- Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Bromethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2-D
- ethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy,
- 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;

PCT/EP98/04636

-  $C_1-C_4$ -Alkylsulfonyl ( $C_1-C_4$ -Alkyl-S(=0)<sub>2</sub>-): Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl und 1,1-Dimethylethylsulfonyl;

- 5 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl wie voranstehend genannt, sowie Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, sulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentyl-
- sulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl,
  4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl,
  1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl,
  2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl,
  3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethyl-
- butylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- 25

  2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl,
  2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl,
- 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl,
- 1+(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl, Nonafluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und
  Dodecafluorhexylsulfonyl;
  - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyliminooxy: Methyliminooxy, Ethyliminooxy, 1-Propyliminooxy, 2-Propyliminooxy, 1-Butyliminooxy und 2-Butyliminooxy;
- 45 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl: Prop-1-en-1-yl, Prop-2-en-1-yl, 1-Methyl-ethenyl, Buten-1-yl, Buten-2-yl, Buten-3-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-prop-2-en-

```
1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, Penten-1-yl, Penten-2-yl,
       Penten-3-yl, Penten-4-yl, 1-Methyl-but-1-en-1-yl, 2-Methyl-
       but-1-en-1-yl, 3-Methyl-but-1-en-1-yl, 1-Methyl-
       but-2-en-1-yl, 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-
       but-2-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-
 5
       but-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-
       prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-
       prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl, 1-Ethyl-
       prop-2-en-1-yl, Hex-1-en-1-yl, Hex-2-en-1-yl, Hex-3-en-1-yl,
       Hex-4-en-1-yl, Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Me-
10
       thyl-pent-1-en-1-yl, 3-Methyl-pent-1-en-1-yl, 4-Methyl-
       pent-1-en-1-yl, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl, 2-Methyl-
       pent-2-en-1-yl, 3-Methyl-pent-2-en-1-yl, 4-Methyl-
       pent-2-en-1-yl, 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-
       pent-3-en-1-yl, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-
15
       pent-3-en-1-yl, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-
       pent-4-en-1-yl, 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-
       pent-4-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-
       but-3-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-
       but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-
20
       but-1-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-
       but-3-en-1-yl, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-
       but-1-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-
       but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-
       but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-1-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl,
25
       1-Ethyl-but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl, 2-Ethyl-
       but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-
       prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl,
       1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl und 1-Ethyl-2-methyl-
30
       prop-2-en-1-y1;
       C_2-C_6-Alkenyl: C_3-C_6-Alkenyl wie voranstehend genannt, sowie
       Ethenyl;
       C3-C6-Alkinyl: Prop-1-in-1-yl, Prop-2-in-1-yl, But-1-in-1-yl,
       But-1-in-3-yl, But-1-in-4-yl, But-2-in-1-yl, Pent-1-in-1-yl,
35
        Pent-1-in-3-yl, Pent-1-in-4-yl, Pent-1-in-5-yl,
        Pent-2-in-1-yl, Pent-2-in-4-yl, Pent-2-in-5-yl,
        3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl,
        Hex-1-in-1-yl, Hex-1-in-3-yl, Hex-1-in-4-yl, Hex-1-in-5-yl,
        Hex-1-in-6-yl, Hex-2-in-1-yl, Hex-2-in-4-yl, Hex-2-in-5-yl,
40
        Hex-2-in-6-yl, Hex-3-in-1-yl, Hex-3-in-2-yl, 3-Methyl-
        pent-1-in-1-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl, 3-Methyl-
        pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl, 4-Methyl-
        pent-1-in-1-yl, 4-Methyl-pent-2-in-4-yl und 4-Methyl-
        pent-2-in-5-yl;
```

-  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl:  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyl, wie voranstehend genannt, sowie Ethinyl:

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und
   Cyclohexyl;
  - C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl: Cyclobuten-1-yl, Cyclobuten-3-yl, Cyclopenten-1-yl, Cyclopenten-3-yl, Cyclopenten-4-yl, Cyclohexen-1-yl, Cyclohexen-3-yl und Cyclohexen-4-yl;
- 10 Heterocyclyl, sowie die Heterocyclylreste in Heterocyclyloxy: drei- bis siebengliedrige, gesättigte oder partiell ungesättigte mono- oder polycyclische Heterocyclen, die ein bis drei Heteroatome ausgewählt aus einer Gruppe bestehend aus Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel enthalten, wie Oxiranyl,
- 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl,
  3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl,
  3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxa-
- zolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl,
  4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl,
  4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadia-
- thien-5-yl, 2,5-Dihydrothien-2-yl, 2,5-Dihydrothien-3-yl, 2,3-Dihydropyrrol-2-yl, 2,3-Dihydropyrrol-3-yl, 2,3-Dihydropyrrol-2-yl, 2,5-Dihydropyrrol-2-yl, 2,5-Dihydropyrrol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisoxa-
- zol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-5-yl, 4,5-Dihydroisothia-zol-3-yl, 4,5-Dihydroisothia-
- zol-5-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,5-Dihydroisothia-zol-4-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydro-pyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 2,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,5-Dihydropyrazol-5-yl,
- pyrazol-3-yl, 2,5-Dihydropyrazol-4-yl, 2,5-Dihydro-pyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydro-

oxazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,5-Dihydrooxazol-2-yl, 2,5-Dihydrooxazol-4-yl, 2,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrothiazol-2-yl, 2,3-Dihydrothiazol-4-yl, 2,3-Dihydrothiazol-5-yl, 4,5-Dihydrothiazol-2-yl, 4,5-Dihydrothiazol-4-yl, 4.5-Dihydrothiazol-5-yl, 2.5-Dihydrothiazol-2-yl, 2.5-Dihy-5 drothiazol-4-yl, 2,5-Dihydrothiazol-5-yl, 2,3-Dihydroimidazol-2-yl, 2,3-Dihydroimidazol-4-yl, 2,3-Dihydroimidazol-5-yl, 4,5-Dihydroimidazol-2-yl, 4,5-Dihydroimidazol-4-yl, 4,5-Dihydroimidazol-5-y1, 2,5-Dihydroimidazol-2-y1, 2,5-Dihydroimida-10 zol-4-v1, 2,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2-Morpholinyl, 3-Morpholinyl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl, 2-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydrotriazin-2-yl, 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl, 1,3-Dihydro-15 oxazin-2-yl, 1,3-Dithian-2-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothiopyranyl, 3-Tetrahydrothiopyranyl, 4-Tetrahydrothiopyranyl, 1,3-Dioxolan-2-yl, 3,4,5,6-Tetrahydropyridin-2-yl, 4H-1,3-Thiazin-2-yl, 4H-3,1-Benzothiazin-2-yl, 20 1,1-Dioxo-2,3,4,5-tetrahydrothien-2-yl, 2H-1,4-Benzothiazin-3-yl, 2H-1,4-Benzoxazin-3-yl, 1,3-Dihydrooxazin-2-yl, Hetaryl, sowie die Hetarylreste in Hetaryloxy: aromatische mono- oder polycyclische Reste, welche neben 25 Kohlenstoffringgliedern zusätzlich ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Sauerstoffoder ein Schwefelatom oder ein Sauerstoff- und ein Schwefelatom enthalten können, z. B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 30 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-y1, 1,2,4-Oxadiazol-5-y1, 35 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-y1, 1,3,4-0xadiazol-2-y1, 1,3,4-Thiadiazol-2-y1, 1,3,4-Triazol-2-yl, 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Tri-40 azin-3-yl, 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, sowie die entsprechenden

Alle Phenyl-, Hetaryl- und Heterocyclylringe sind vorzugsweise unsubstituiert oder tragen ein bis drei Halogenatome und/oder einen oder zwei Reste aus folgender Gruppe: Nitro, Cyano, Methyl, Trifluormethyl, Methoxy, Trifluormethoxy oder Methoxycarbonyl.

benzokondensierten Derivate.

In Hinblick auf die Verwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I als Herbizide haben die Variablen vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination:

- R<sup>1</sup> Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogen-alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_6$ -alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl, -OR<sup>3</sup> oder -S(O)<sub>n</sub>R<sup>3</sup>;
- besonders bevorzugt Nitro, Halogen wie z.B. Fluor, Chlor oder Brom,  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl,  $-OR^3$  oder  $-SO_2R^3$ ;
- $\label{eq:R2} R^2 \quad \text{Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano, $C_1-C_6-Alky1$,} \\ \quad C_1-C_6-Halogenalky1$, $C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alky1$, $C_2-C_6-Alkeny1$,} \\ \quad C_2-C_6-Alkiny1$, $-OR^3$ oder $-S(O)_nR^3$;}$ 
  - besonders bevorzugt Wasserstoff, Nitro, Halogen wie z.B. Fluor, Chlor oder Brom,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl, -OR<sup>3</sup> oder -SO<sub>2</sub>R<sup>3</sup>;
- Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, Phenyl oder Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;
  besonders bevorzugt Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Alkinyl oder Phenyl; wobei die genannten Alkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:
- - n 0, 1 oder 2, besonders bevorzugt 0 oder 2;
- X¹ eine geradkettige oder verzweigte C₁-C₄-Alkylen-, eine Propylen- oder Butenylen- oder eine C₂-C₄-Alkinylenkette, besonders bevorzugt eine Methylen-, Ethylen-, Propylen-, Propenylen-, Ethinylen oder Propinylenkette, wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkinylenreste partiell halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

 $-OR^4$ ,  $-OCOR^4$ ,  $-OCONHR^4$  oder  $-OSO_2R^4$ 

und wobei die genanten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in  $\alpha,\beta$ -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die  $\beta$ -Position an die Doppelbindung gebunden ist;

- $R^4$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl; besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;
  - $C_1-C_6-Alkyl$  oder  $C_1-C_6-Halogenalkyl$ ; besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl oder Isobutyl;
- 15  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$ ,  $R^{11}$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl; besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Ethyl;
- R8 Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Cycloalkyl, wobei die beiden letztgenannten Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio;

Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl,

- 1,3-Dithian-2-yl oder 1,3-Dithiolan-2-yl, wobei die sechs letztgenannten Gruppen jeweils einen bis drei C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylreste tragen können;
- besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Cyclopropyl,
  Di(methoxy)methyl, Di(ethoxy)methyl, 2-Ethylthiopropyl,
  Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl, Tetrahydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
- 1,3-Dioxan-2-yl, 5,5-Dimethyl-1,3-dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 5,5-Dimethyl-1,3-dithian-2-yl oder 1-Methylthiocyclopropyl;
  - $R^{10}$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl; besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Methoxycarbonyl.
- Ebenso kann vorteilhaft in Betracht kommen, daß  $R^8$  und  $R^{11}$  eine  $\pi$ -Bindung ausbilden, so daß ein Doppelbindungssystem entsteht.

Die CR8R9-Einheit kann auch vorteilhaft durch C=O ersetzt werden.

Insbesondere bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, wobei  $\mathbb{R}^1$  in Position 2 und  $\mathbb{R}^2$  in Position 4 des Phenylringes gebunden sind.

5

$$Q$$
 $R^1$ 
 $R^2$ 
Het

10

Ιa

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, in der die Substituenten  $R^1$  und  $R^2$  und Q die oben genannte Bedeutung 15 haben,  $X^1$  für eine  $C_1$ - $C_2$ -Alkylen- oder eine  $C_2$ -Alkinylenkette steht und

Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

25

wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/ oder durch  $\mathbb{R}^5$  substituiert sein kann;

30 bedeutet.

Insbesondere bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, wobei  $\mathbb{R}^1$  in Position 2 und  $\mathbb{R}^2$  in Position 4 des Phenylringes gebunden sind.

40

Ιa

WO 99/07688 PCT/EP98/04636

25

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia, in der die Substituenten  $R^1$  und  $R^2$  und Q die oben genannte Bedeutung haben,  $X^1$  für eine Gruppe für eine  $C_1$ - $C_2$ -Alkylen- oder eine  $C_2$ -Alkinylenkette steht und

5

Het eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

10

15

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

wobei die genannte heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/ oder durch R<sup>5</sup> substituiert sein kann;

bedeutet.

Darüber hinaus sind die erfindungsgemäßen Verbindungen der For20 mel Ia außerordentlich bevorzugt, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>
und X<sup>1</sup> die oben genannte Bedeutung haben und Het für eine fünfoder sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte
heterocyclische oder eine fünf- oder sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der
25 Gruppe

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel

steht.

30

Insbesondere bevorzugt sind die Verbindungen Ib der Tabellen 1 bis 36.

35

40

Tabelle A

	Nr.	X1	Het
5	1	CH <sub>2</sub>	Oxiranyl
	2	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-2-oxiranyl
	3	CH <sub>2</sub>	2-Oxetanyl
	4	CH <sub>2</sub>	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
10	5	CH <sub>2</sub>	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	6	CH <sub>2</sub>	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
	7	CH <sub>2</sub>	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
15	8	CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	9	CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	10	CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	11	CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	12	CH <sub>2</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
20	13	CH <sub>2</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	14	CH <sub>2</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	15	CH <sub>2</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
25 -	16	CH <sub>2</sub>	3-Oxetanyl
	17	CH <sub>2</sub>	2–Furyl
	18	CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-2-furyl
	19	CH <sub>2</sub>	2,3–Dihydro–2–furyl
30	20	CH <sub>2</sub>	3–Furyl
	21	CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-3-furyl
	22	CH <sub>2</sub>	2,3-Dihydro-3-furyl
	23	CH <sub>2</sub>	2-Thienyl
35	24	CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-2-thienyl
	25	CH <sub>2</sub>	2,3–Dihydro–2–thienyl
	26	CH <sub>2</sub>	5-Chlor-2-thienyl
	_ 27	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-2-thienyl
40	28	CH <sub>2</sub>	3-Thienyl
	29	CH <sub>2</sub>	4,5—Dihydro–3—thienyl
	30	CH <sub>2</sub>	2,3–Dihydro–3–thienyl
4 -	31	CH <sub>2</sub>	2—Pyrrolyl
45	32	CH <sub>2</sub>	2,5–Dihydro–2–pyrrolyl
	33	CH <sub>2</sub>	3Pyrrolyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het :
	34	CH <sub>2</sub>	2,5–Dihydro–3–pyrrolyl
	35	CH <sub>2</sub>	3—Isoxazolyl
5	36	CH <sub>2</sub>	4-Methyl-3-isoxazolyl
	37	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-3-isoxazolyl
	38	CH <sub>2</sub>	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
. [	39	CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
10	40	CH <sub>2</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	41	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	42	CH <sub>2</sub>	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
15	43	CH <sub>2</sub>	4-Isoxazolyl
	44	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4-isoxazolyl
	45	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4-isoxazolyl
	46	CH <sub>2</sub>	5—Cyclopropyl—4—isoxazolyl
20	47	CH <sub>2</sub>	5-Phenyl-4-isoxazolyl
	48	CH <sub>2</sub>	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
	49	CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
	50	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
25	51	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	52	CH <sub>2</sub>	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	53	CH <sub>2</sub>	5-Isoxazolyl
	54	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-5-isoxazolyl
30	55	CH <sub>2</sub>	4-Methyl-5isoxazolyl
	56	CH <sub>2</sub>	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
	57	CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
35	58	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
35	59	CH <sub>2</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	60	CH <sub>2</sub>	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	61	CH <sub>2</sub>	3-Isothiazolyl
40	62	CH <sub>2</sub>	4-Methyl-3-isothiazolyl
	63	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-3-isothiazolyl
	64	CH <sub>2</sub>	4-Isothiazolyl
	65	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4-isothiazolyl
45	66	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4-isothiazolyl
	67	CH <sub>2</sub>	5-Isothiazolyl
	68	CH <sub>2</sub>	3-Methyl-5-isothiazolyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	69	CH <sub>2</sub>	4-Methyl-5-isothiazolyl
	70	CH <sub>2</sub>	2-Oxazolyl
5	71	CH <sub>2</sub>	4-Oxazolyl
	72	CH <sub>2</sub>	5-Oxazolyl
	73	CH <sub>2</sub>	2-Thiazolyl
. [	74	CH <sub>2</sub>	4—Thiazolyl
10	75	CH <sub>2</sub>	5-Thiazolyl
Γ	76	CH <sub>2</sub>	3-Pyrazolyl
ſ	77	CH <sub>2</sub>	4-Pyrazolyl
15	78	CH <sub>2</sub>	1-Methyl-3-pyrazolyl
	79	CH <sub>2</sub>	1-Methyl-4-pyrazolyl
	80	CH <sub>2</sub>	1-Methyl-5-pyrazolyl
	81	CH <sub>2</sub>	2–Imidazolyl
20	82	CH <sub>2</sub>	1-Methyl-2-imidazolyl
	83	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
[	84	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
	85	CH <sub>2</sub>	5-Methyl[1,3,4]-2-thiadiazolyl
25	86	CH <sub>2</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
	87	CH <sub>2</sub>	[1,2,4]-3-triazolyl
	88	CH <sub>2</sub>	[1,2,3]-4-triazolyl
	89	CH <sub>2</sub>	2-Pyridyl
30	90	CH <sub>2</sub>	6-Chlor-2-pyridyl
	91	CH <sub>2</sub>	6-Methoxy-2-pyridyl
	92	CH <sub>2</sub>	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
35	93	CH <sub>2</sub>	3-Pyridyl
30	94	CH <sub>2</sub>	2–Chlor–3–pyridyl
	95	CH <sub>2</sub>	2-Methoxy-3-pyridyl
	96	CH <sub>2</sub>	4–Pyridyl
40	`97	CH <sub>2</sub>	2-Chlor-4-pyridyl
	98	CH <sub>2</sub>	2-Methoxy-4-pyridyl
	99	CH <sub>2</sub>	2–Ethoxy–4–pyridyl
	100	CH <sub>2</sub>	2-Methylthio-4-pyridyl
45	101	CH <sub>2</sub>	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
	102	CH <sub>2</sub>	2—Pyrimidiny1
	103	CH <sub>2</sub>	3-Pyrimidinyl

Γ	Nr.	$X^{1}$	Het
	104	CH <sub>2</sub>	4-Pyrimidinyl
	105	CH <sub>2</sub>	2-Pyrazinyl
5	106	CH <sub>2</sub>	3-Pyridazinyl
	107	CH <sub>2</sub>	4-Pyridazinyl
	108	CH <sub>2</sub>	2(2H-1,3-oxazinyl)
[	109	CH <sub>2</sub>	2-(6 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
10	110	CH <sub>2</sub>	4-(6 <i>H</i> -1,3oxazinyl)
Γ	111	CH <sub>2</sub>	6–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
	112	CH <sub>2</sub>	[1,3,5]–2–Triazinyl
15	113	CH <sub>2</sub>	[1,2,4]–3–Triazinyl
	114	CH <sub>2</sub>	[1,2,4]–5–Triazinyl
Γ	115	CH <sub>2</sub>	[1,2,4]–6–Triazinyl
	116	CHCH <sub>3</sub>	Oxiranyl
20	117	CHCH <sub>3</sub>	3-Methyl-2-oxiranyl
	118	СНСН3	2-Oxetanyl
	119	CHCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	120	CHCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
25	121	CHCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
	122	CHCH <sub>3</sub>	3–Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
	123	CHCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	124	CHCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
30	125	CHCH₃	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	126	СНСН3	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	127	CHCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
<u> </u>	128	CHCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
35	129	CHCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	130	CHCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
	131	CHCH <sub>3</sub>	3-Oxetanyl
40	132	CHCH <sub>3</sub>	2Furyl
	133	CHCH <sub>3</sub>	4,5–Dihydro–2–furyl
	134	CHCH <sub>3</sub>	2,3—Dihydro—2—furyl
	135	CHCH <sub>3</sub>	3–Furyl
45	136	CHCH <sub>3</sub>	4,5—Dihydro—3—furyl
	137	CHCH <sub>3</sub>	2,3–Dihydro–3–furyl
	138	CHCH <sub>3</sub>	2-Thienyl

	Nr.	$X^{1}$	Het
	139	СНСН3	4,5-Dihydro-2-thienyl
	140	СНСН3	2,3-Dihydro-2-thienyl
5	141	CHCH <sub>3</sub>	5-Chlor-2-thienyl
	142	СНСН3	5-Methyl-2-thienyl
	143	CHCH <sub>3</sub>	3-Thienyl
[	144	СНСН3	4,5-Dihydro-3-thienyl
10	145	CHCH <sub>3</sub>	2,3-Dihydro-3-thienyl
	146	CHCH <sub>3</sub>	2Pyrrolyl
Γ	147	CHCH <sub>3</sub>	2,5–Dihydro–2–pyrrolyl
15	148	CHCH <sub>3</sub>	3-Pyrrolyi
	149	CHCH <sub>3</sub>	2,5–Dihydro–3–pyrrolyl
	150	CHCH <sub>3</sub>	3—Isoxazolyl
	151	CHCH <sub>3</sub>	4-Methyl-3-isoxazolyl
20	152	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isoxazolyl
	153	CHCH <sub>3</sub>	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
Ī	154	CHCH <sub>3</sub>	4,5Dihydro3-isoxazolyl
Ī	155	CHCH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
25	156	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
Ī	157	CHCH <sub>3</sub>	4,5—Dimethyl—4,5—dihydro—3—isoxazolyl
	158	CHCH <sub>3</sub>	4–Isoxazolyl
	159	CHCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4-isoxazolyl
30	160	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-4-isoxazolyl
	161	СНСН3	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	162	CHCH <sub>3</sub>	5-Phenyl-4-isoxazolyl
[	163	CHCH <sub>3</sub>	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl
35	164	CHCH <sub>3</sub>	4,5—Dihydro–4—isoxazolyl
	165	CHCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	166	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
40	167	CHCH <sub>3</sub>	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
10	168	CHCH <sub>3</sub>	5Isoxazolyl
	169	CHCH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isoxazolyl
	170	CHCH <sub>3</sub>	4-Methyl-5-isoxazolyl
45	171	CHCH <sub>3</sub>	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
	172	CHCH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
	173	CHCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl

	Nr.	X¹	Het
	174	CHCH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
ſ	175	CHCH <sub>3</sub>	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
5	176	CHCH <sub>3</sub>	3-Isothiazolyl
	177	СНСН3	4-Methyl-3-isothiazolyl
	178	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isothiazolyl
. [	179	CHCH <sub>3</sub>	4-Isothiazolyl
10	180	CHCH₃	3-Methyl-4-isothiazolyl
	181	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-4-isothiazolyl
	182	СНСН3	5Isothiazolyl
15	183	CHCH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isothiazolyl
	184	CHCH <sub>3</sub>	4-Methyl-5-isothiazolyl
	185	CHCH <sub>3</sub>	2–Oxazolyl
	186	CHCH <sub>3</sub>	4-Oxazolyl
20	187	CHCH <sub>3</sub>	5-Oxazolyl
	188	CHCH <sub>3</sub>	2—Thiazolyl
	189	CHCH <sub>3</sub>	4—Thiazolyl
	190	CHCH <sub>3</sub>	5-Thiazolyl
25	191	CHCH <sub>3</sub>	3—Pyrazolyl
	192	CHCH <sub>3</sub>	4-Pyrazolyl
	193	CHCH <sub>3</sub>	1-Methyl-3-pyrazolyl
	194	CHCH <sub>3</sub>	1-Methyl-4-pyrazolyl
30	195	СНСН3	1-Methyl-5-pyrazolyl
	196	CHCH <sub>3</sub>	2—Imidazolyl
	197	CHCH <sub>3</sub>	1-Methyl-2-imidazolyl
25	198	CHCH <sub>3</sub>	5—Methyl—[1,3,4]—2—oxadiazolyl
35	199	СНСН3	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
	200	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
	201	CHCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
40	202	CHCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–3–triazolyl
	203	CHCH <sub>3</sub>	[1,2,3]—4—triazolyl
1	204	CHCH <sub>3</sub>	2–Pyridyl
	205	CHCH <sub>3</sub>	6Chlor-2-pyridyl
45	206	CHCH <sub>3</sub>	6-Methoxy-2-pyridyl
	207	CHCH <sub>3</sub>	6—Trifluormethyl—2—pyridyl
	208	CHCH <sub>3</sub>	3-Pyridyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	209	CHCH₃	2-Chlor-3-pyridyl
	210	CHCH <sub>3</sub>	2-Methoxy-3-pyridyl
5	211	CHCH <sub>3</sub>	4–Pyridyl
	212	CHCH <sub>3</sub>	2-Chlor-4-pyridyl
	213	CHCH <sub>3</sub>	2-Methoxy-4-pyridyl
. [	214	CHCH <sub>3</sub>	2–Ethoxy–4–pyridyl
10	215	CHCH <sub>3</sub>	2-Methylthio-4-pyridyl
[	216	CHCH <sub>3</sub>	2—Trifluormethyl—5—pyridyl
	217	CHCH <sub>3</sub>	2–Pyrimidinyl
15	218	CHCH <sub>3</sub>	3–Pyrimidinyl
	219	CHCH <sub>3</sub>	4—Pyrimidinyl
	220	CHCH <sub>3</sub>	2—Pyrazinyl
	221	CHCH <sub>3</sub>	3-Pyridazinyl
20	222	СНСН3	4-Pyridazinyl
	223	СНСН3	2-(2H-1,3oxazinyl)
	224	CHCH <sub>3</sub>	2-(6H-1,3-oxazinyl)
	225	CHCH <sub>3</sub>	4-(6 <i>H</i> 1,3oxazinyl)
25	226	CHCH <sub>3</sub>	6-(6H-1,3-oxazinyl)
	227	CHCH <sub>3</sub>	[1,3,5]-2-Triazinyl
	228	CHCH <sub>3</sub>	[1,2,4]—3—Triazinyl
	229	CHCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–5–Triazinyl
30	230	CHCH <sub>3</sub>	[1,2,4]-6-Triazinyl
	231	СНОН	Oxiranyl
	232	СНОН	3-Methyl-2-oxiranyl
2 =	233	СНОН	2Oxetanyl
35	234	СНОН	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	235	СНОН	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	236	СНОН	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
40	237	СНОН	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
10	238	СНОН	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	239	СНОН	3Methoxy3ethyl2-oxetanyl
	240	СНОН	3—Methoxy—3—propyl—2—oxetanyl
45	241	СНОН	3—Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	242	СНОН	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
	243	СНОН	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	244	СНОН	3—Trimethylsilyloxy—3—propyl—2—oxetanyl
	245	СНОН	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
5	246	СНОН	3-Oxetanyl
	247	СНОН	2–Furyl
	248	СНОН	4,5—Dihydro-2furyl
	249	СНОН	2,3–Dihydro–2–furyl
10	250	СНОН	3–Furyl
	251	СНОН	4,5-Dihydro-3-furyl
	252	СНОН	2,3-Dihydro-3-furyl
15	253	СНОН	2-Thienyl
	254	СНОН	4,5-Dihydro-2-thienyl
	255	СНОН	2,3—Dihydro-2-thienyl
	256	СНОН	5-Chlor-2-thienyl
20	257	СНОН	5-Methyl-2-thienyl
	258	СНОН	3-Thienyl
	259	СНОН	4,5-Dihydro-3-thienyl
	260	СНОН	2,3–Dihydro–3–thienyl
25	261	СНОН	2–Pyrrolyl
	262	СНОН	2,5–Dihydro–2–pyrrolyl
[	263	СНОН	3Pyrrolyl
	264	СНОН	2,5—Dihydro–3–pyrrolyl
30	265	СНОН	3Isoxazolyl
	266	СНОН	4-Methyl-3-isoxazolyl
	267	СНОН	5-Methyl-3-isoxazolyl
35	268	СНОН	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
35	269	СНОН	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
	270	СНОН	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	271	СНОН	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
40	272	СНОН	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	273	СНОН	4-Isoxazolyl
	274	СНОН	3-Methyl-4-isoxazolyl
	275	СНОН	5-Methyl-4-isoxazolyl
45	276	СНОН	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	277	СНОН	5—Phenyl—4—isoxazolyl
	278	СНОН	3,5-Dimethyl-4-isoxazolyl

Γ	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
Γ	279	СНОН	4,5–Dihydro–4–isoxazolyl
	280	СНОН	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
5	281	СНОН	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	282	СНОН	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	283	СНОН	5-Isoxazolyl
	284	СНОН	3-Methyl-5-isoxazolyl
10	285	СНОН	4-Methyl-5-isoxazolyl
	286	СНОН	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
	287	СНОН	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
15	288	СНОН	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	289	СНОН	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	290	СНОН	3,4—Dimethyl—4,5—dihydro—5—isoxazolyl
	291	СНОН	3Isothiazolyl
20	292	СНОН	4-Methyl-3-isothiazolyl
	293	СНОН	5-Methyl-3-isothiazolyl
	294	СНОН	4Isothiazolyl
	295	СНОН	3-Methyl-4-isothiazolyl
25	296	СНОН	5-Methyl-4-isothiazolyl
	297	СНОН	5—Isothiazolyl
	298	СНОН	3-Methyl-5-isothiazolyl
	299	СНОН	4-Methyl-5-isothiazolyl
30	300	СНОН	2–Oxazolyl
	301	СНОН	4-Oxazolyl
	302	СНОН	5-Oxazolyl
35	303	СНОН	2—Thiazolyl
33	304	СНОН	4-Thiazolyl
	305	СНОН	5-Thiazolyl
	306	СНОН	3-Pyrazolyl
40	`307	СНОН	4–Pyrazolyl
	308	СНОН	1-Methyl-3-pyrazolyl
	309	СНОН	1-Methyl-4-pyrazolyl
	310	СНОН	1-Methyl-5-pyrazolyl
45	311	СНОН	2-Imidazolyl
	312	СНОН	1-Methyl-2-imidazolyl
	313	СНОН	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl

Γ	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
-	314	СНОН	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
F	315	СНОН	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
5	316	СНОН	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
	317	СНОН	[1,2,4]–3–triazolyl
	318	СНОН	[1,2,3]—4-triazolyl
	319	СНОН	2Pyridyl
10	320	СНОН	6–Chlor–2–pyridyl
Ī	321	СНОН	6-Methoxy-2-pyridyl
Γ	322	СНОН	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
15	323	СНОН	3–Pyridyl
	324	СНОН	2-Chlor-3-pyridyl
	325	СНОН	2-Methoxy-3-pyridyl
	326	СНОН	4-Pyridyl
20	327	СНОН	2-Chlor-4-pyridyl
	328	СНОН	2-Methoxy-4-pyridyl
	329	СНОН	2-Ethoxy-4-pyridyl
	330	СНОН	2-Methylthio-4-pyridyl
25	331	СНОН	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
	332	СНОН	2-Pyrimidinyl
	333	СНОН	3-Pyrimidinyl
Ī	334	СНОН	4-Pyrimidinyl
30	335	СНОН	2–Pyrazinyl
	336	СНОН	3—Pyridazinyl
	337	СНОН	4-Pyridazinyl
35	338	СНОН	2–(2 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
,,	339	СНОН	2–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
	340	СНОН	4–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
	341	СНОН	6–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
40	342	СНОН	[1,3,5]–2–Triazinyl
	343	СНОН	[1,2,4]–3–Triazinyl
	344	СНОН	[1,2,4]–5–Triazinyl
	345	СНОН	[1,2,4]–6–Triazinyl
45	346	CHOCH <sub>3</sub>	Oxiranyl
	347	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-2-oxiranyl
	348	CHOCH <sub>3</sub>	2—Oxetanyl

Γ	Nr.	$\mathbf{X}^1$	Het
F	349	CHOCH₃	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	350	CHOCH₃	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
5	351	CHOCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
	352	CHOCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
	353	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	354	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
10	355	CHOCH₃	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	356	СНОСН₃	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
Ī	357	CHOCH <sub>3</sub>	3—Trimethylsilyloxy—3-methyl-2-oxetanyl
15	358	CHOCH <sub>3</sub>	3—Trimethylsilyloxy—3—ethyl—2—oxetanyl
	359	CHOCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	360	CHOCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-buty-2-oxetanyl
	361	CHOCH <sub>3</sub>	3-Oxetanyl
20	362	CHOCH <sub>3</sub>	2–Furyl
	363	CHOCH <sub>3</sub>	4,5–Dihydro–2–furyl
	364	СНОСН3	2,3-Dihydro-2-furyl
	365	СНОСН3	3–Furyl
25	366	CHOCH <sub>3</sub>	4,5–Dihydro–3–furyl
	367	CHOCH <sub>3</sub>	2,3–Dihydro–3–furyl
	368	CHOCH <sub>3</sub>	2-Thienyl
	369	CHOCH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-2-thienyl
30	370	CHOCH <sub>3</sub>	2,3-Dihydro-2-thienyl
	371	CHOCH <sub>3</sub>	5-Chlor-2-thienyl
	372	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-2-thienyl
35	373	CHOCH <sub>3</sub>	3-Thienyl
35	374	CHOCH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-3-thienyl
	375	CHOCH <sub>3</sub>	2,3—Dihydro—3—thienyl
	376	CHOCH <sub>3</sub>	2Pyrrolyl
40	377	CHOCH <sub>3</sub>	2,5–Dihydro–2–pyrrolyl
	378	CHOCH <sub>3</sub>	3Pyrrolyl
	379	CHOCH <sub>3</sub>	2,5–Dihydro–3–pyrrolyl
	380	CHOCH <sub>3</sub>	3Isoxazolyl
45	381	СНОСН3	4-Methyl-3-isoxazolyl
	382	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isoxazolyl
	383	СНОСН3	4,5—Dimethyl—3—isoxazolyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	384	CHOCH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-3-isoxazolyl
	385	CHOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
5	386	СНОСН3	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
Γ	387	CHOCH <sub>3</sub>	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	388	CHOCH <sub>3</sub>	4—Isoxazolyl
. [	389	СНОСН3	3-Methyl-4-isoxazolyl
10	390	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-4-isoxazolyl
Γ	391	CHOCH <sub>3</sub>	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	392	CHOCH <sub>3</sub>	5-Phenyl-4-isoxazolyl
15	393	CHOCH <sub>3</sub>	3,5—Dimethyl—4-isoxazolyl
	394	CHOCH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
	395	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	396	CHOCH₃	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
20	397	CHOCH <sub>3</sub>	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	398	CHOCH <sub>3</sub>	5Isoxazolyl
	399	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isoxazolyl
	400	СНОСН3	4-Methyl-5-isoxazolyl
25	401	CHOCH <sub>3</sub>	3,4—Dimethyl—5—isoxazolyl
	402	СНОСН3	4,5—Dihydro–5—isoxazolyl
	403	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	404	CHOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
30	405	CHOCH <sub>3</sub>	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	406	CHOCH <sub>3</sub>	3—Isothiazolyl
	407	CHOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-3-isothiazolyl
2.	408	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isothiazolyl
35	409	CHOCH <sub>3</sub>	4-lsothiazolyl
	410	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4-isothiazolyl
	411	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-4-isothiazolyl
40	412	CHOCH <sub>3</sub>	5—Isothiazolyl
	413	CHOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isothiazolyl
	414	CHOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-5-isothiazolyl
	415	СНОСН3	2–Oxazolyl
45	416	CHOCH <sub>3</sub>	4-Oxazolyl
	417	CHOCH <sub>3</sub>	5-Oxazolyl
	418	CHOCH₃	2-Thiazolyl

	Nr.	Χ <sup>1</sup>	Het
	419	CHOCH <sub>3</sub>	4—Thiazolyl
	420	CHOCH <sub>3</sub>	5-Thiazolyl
5	421	CHOCH <sub>3</sub>	3—Pyrazolyl
	422	CHOCH₃	4—Pyrazolyl
	423	CHOCH <sub>3</sub>	1-Methyl-3-pyrazolyl
	424	CHOCH₃	1-Methyl-4-pyrazolyl
10	425	CHOCH <sub>3</sub>	1—Methyl—5ругаzolyl
Ī	426	CHOCH <sub>3</sub>	2—Imidazolyl
	427	СНОСН3	1-Methyl-2-imidazolyl
15	428	СНОСН3	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
	429	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
	430	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
	431	CHOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
20	432	СНОСН3	[1,2,4]–3triazolyl
	433	CHOCH <sub>3</sub>	[1,2,3] 4-triazolyl
	434	СНОСН3	2—Pyridyl
	435	CHOCH <sub>3</sub>	6Chlor-2pyridyl
25	436	CHOCH <sub>3</sub>	6-Methoxy-2-pyridyl
	437	CHOCH <sub>3</sub>	6Trifluormethyl2pyridyl
	438	CHOCH <sub>3</sub>	3–Pyridyl
	439	CHOCH <sub>3</sub>	2-Chlor-3-pyridyl
30	440	CHOCH <sub>3</sub>	2-Methoxy-3-pyridyl
	441	CHOCH <sub>3</sub>	4–Pyridyl
	442	CHOCH₃	2-Chlor-4-pyridyl
2.5	443	CHOCH <sub>3</sub>	2-Methoxy-4-pyridyl
35	444	CHOCH <sub>3</sub>	2-Ethoxy-4-pyridyl
	445	CHOCH <sub>3</sub>	2-Methylthio-4-pyridyl
	446	CHOCH <sub>3</sub>	2—Trifluormethyl—5—pyridyl
40	447	CHOCH <sub>3</sub>	2Pyrimidinyl
	448	CHOCH <sub>3</sub>	3-Pyrimidinyl
	449	CHOCH <sub>3</sub>	4-Pyrimidinyl
	450	CHOCH <sub>3</sub>	2-Pyrazinyl
45	451	CHOCH <sub>3</sub>	3-Pyridazinyl
	452	CHOCH₃	4-Pyridazinyl
	453	CHOCH <sub>3</sub>	2-(2 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)

Γ	Nr.	X1	Het
	454	CHOCH <sub>3</sub>	2-(6H-1,3-oxazinyl)
	455	CHOCH <sub>3</sub>	4–(6H–1,3–oxazinyl)
5	456	CHOCH <sub>3</sub>	6-(6H-1,3-oxazinyl)
	457	CHOCH <sub>3</sub>	[1,3,5]–2–Triazinyl
	458	CHOCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–3–Triazinyl
[	<b>4</b> 59	CHOCH <sub>3</sub>	[1,2,4]—5—Triazinyl
10	<b>4</b> 60	CHOCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–6Triazinyl
	461	CHOCOCH <sub>3</sub>	Oxiranyl
Γ	462	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-2-oxiranyl
15	463	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Oxetanyl
	464	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	465	CHOCOCH <sub>3</sub>	3–Hydroxy–3–ethyl–2–oxetanyl
	466	CHOCOCH <sub>3</sub>	3Hydroxy3-propyl-2-oxetanyl
20	467	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
	468	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	469	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	470	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
25	471	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	472	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
	473	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	474	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
30	475	CHOCOCH3	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
	476	CHOCOCH3	3-Oxetanyl
	477	CHOCOCH3	2–Furyl
2.5	478	CHOCOCH3	4,5-Dihydro-2-furyl
35	479	CHOCOCH <sub>3</sub>	2,3–Dihydro–2–furyl
	480	CHOCOCH3	3–Furyl
	481	CHOCOCH₃	4,5-Dihydro-3-furyl
40	482	CHOCOCH₃	2,3–Dihydro–3–furyl
	483	CHOCOCH₃	2-Thienyl
	484	CHOCOCH₃	4,5—Dihydro–2–thienyl
	485	CHOCOCH <sub>3</sub>	2,3-Dihydro-2-thienyl
45	486	СНОСОСН3	5-Chlor-2-thienyl
	487	CHOCOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-2-thienyl
	488	СНОСОСН3	3-Thienyl

ſ	Nr.	Xi	Het
	489	СНОСОСН₃	4,5–Dihydro–3–thienyl
	490	СНОСОСН₃	2,3–Dihydro–3–thienyl
5	491	СНОСОСН₃	2–Pyrrolyl
	492	СНОСОСН₃	2,5–Dihydro–2–pyrrolyl
	493	СНОСОСН₃	3–Pyrrolyl
. [	494	СНОСОСН3	2,5–Dihydro–3–pyrrolyl
10	495	CHOCOCH <sub>3</sub>	3–Isoxazolyl
	496	CHOCOCH3	4—Methyl—3—isoxazolyl
	497	CHOCOCH <sub>3</sub>	5—Methyl—3—isoxazolyl
15	498	CHOCOCH3	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
	499	CHOCOCH3	4,5–Dihydro–3–isoxazolyl
	500	CHOCOCH3	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	501	CHOCOCH3	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
20	502	CHOCOCH <sub>3</sub>	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	503	CHOCOCH <sub>3</sub>	4–Isoxazolyl
	504	CHOCOCH3	3-Methyl-4-isoxazolyl
	505	CHOCOCH₃	5-Methyl-4-isoxazolyl
25	506	CHOCOCH₃	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	507	CHOCOCH3	5-Phenyl-4-isoxazolyl
[	508	CHOCOCH3	3,5—Dimethyl—4—isoxazolyl
	509	CHOCOCH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-4-isoxazolyl
30	510	CHOCOCH₃	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	511	CHOCOCH₃	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	512	CHOCOCH₃	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
35	513	CHOCOCH₃	5-Isoxazolyl
35	514	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isoxazolyl
	515	CHOCOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-5-isoxazolyl
	516	CHOCOCH <sub>3</sub>	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
40	517	CHOCOCH <sub>3</sub>	4,5—Dihydro–5—isoxazolyl
10	518	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	519	CHOCOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	520	CHOCOCH <sub>3</sub>	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
45	521	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Isothiazolyl
	522	CHOCOCH <sub>3</sub>	4-Methyl-3-isothiazolyl
	523	CHOCOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isothiazolyl

ſ	Nr.	X <sup>†</sup>	Het
	524	СНОСОСН3	4—Isothiazolyl
	525	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Methyl-4-isothiazolyl
5	<b>5</b> 26	СНОСОСН3	5-Methyl-4-isothiazolyl
	527	CHOCOCH <sub>3</sub>	5—Isothiazolyl
	528	СНОСОСН3	3-Methyl-5-isothiazolyl
. [	529	СНОСОСН3	4-Methyl-5-isothiazolyl
10	530	СНОСОСН3	2-Oxazolyl
	531	СНОСОСН3	4-Oxazolyl
	532	СНОСОСН3	5-Oxazolyl
15	533	СНОСОСН3	2-Thiazolyl
	534	СНОСОСН3	4-Thiazolyl
	535	СНОСОСН3	5-Thiazolyl
	536	СНОСОСН3	3-Pyrazolyl
20	537	СНОСОСН3	4-Pyrazolyl
	538	СНОСОСН3	1-Methyl-3-pyrazolyl
	539	СНОСОСН3	l-Methyl-4-pyrazolyl
	540	СНОСОСН3	1-Methyl-5-pyrazolyl
25	541	СНОСОСН3	2-Imidazolyl
	542	CHOCOCH <sub>3</sub>	1-Methyl-2-imidazolyl
	543	CHOCOCH3	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
	544	CHOCOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
30	545	CHOCOCH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
	546	CHOCOCH₃	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
	547	CHOCOCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–3–triazolyl
35	548	CHOCOCH <sub>3</sub>	[1,2,3]-4-triazolyl
33	549	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Pyridyl
	550	CHOCOCH <sub>3</sub>	6Chlor2pyridyl
	551	CHOCOCH <sub>3</sub>	6-Methoxy-2-pyridyl
40	552	CHOCOCH <sub>3</sub>	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
	553	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Pyridyl
	554	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Chlor-3-pyridyl
	555	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Methoxy-3-pyridyl
45	556	CHOCOCH <sub>3</sub>	4–Pyridyl
	557	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Chlor-4-pyridyl
	558	СНОСОСН3	2-Methoxy-4-pyridyl

ſ	Nr.	Xì	Het
	559	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Ethoxy-4-pyridyl
	560	СНОСОСН3	2-Methylthio-4-pyridyl
5	561	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
	562	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-Pyrimidiny!
ſ	563	CHOCOCH <sub>3</sub>	3–Pyrimidinyl
	564	CHOCOCH <sub>3</sub>	4-Pyrimidinyl
10	565	CHOCOCH₃	2-Pyrazinyl
	566	CHOCOCH <sub>3</sub>	3-Pyridazinyl
	567	СНОСОСН₃	4-Pyridazinyl
15	568	CHOCOCH <sub>3</sub>	2-(2H-1,3-oxazinyl)
	569	СНОСОСН3	2–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
	570	CHOCOCH <sub>3</sub>	4–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
	571	CHOCOCH <sub>3</sub>	6–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
20	572	CHOCOCH <sub>3</sub>	[1,3,5]–2–Triazinyl
	573	CHOCOCH₃	[1,2,4]–3–Triazinyl
	574	CHOCOCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–5—Triazinyl
	575	CHOCOCH <sub>3</sub>	[1,2,4]–6–Triazinyl
25	576	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Oxiranyl
	577	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Methyl—2—oxiranyl
	578	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Oxetanyl
	579	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
30	580	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	581	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
	582	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Hydroxy-3-butyl-2-oxetanyl
35	583	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
33	584	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	585	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	586	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
40	587	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Trimethylsilyloxy—3—methyl—2—oxetanyl
	588	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	589	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	590	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Trimethylsilyloxy—3—butyl—2—oxetanyl
45	591	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Oxetanyl
	592	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2–Furyl
	593	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-2-furyl

ſ	Nr.	XÍ	Het
	594	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,3Dihydro2furyl
	595	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Furyl
5	596	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5–Dihydro–3–furyl
Ī	597	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,3–Dihydro–3–furyl
	598	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2—Thienyl
. [	599	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-2-thienyl
10	600	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,3-Dihydro-2-thienyl
	601	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Chlor-2-thienyl
	602	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-2-thienyl
15	603	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Thienyl
	604	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-3-thienyl
	605	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,3-Dihydro-3-thienyl
	606	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2–Pyrrolyl
20	607	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,5—Dihydro—2—pyrrolyl
	608	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3Pyrrolyl
	609	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,5—Dihydro–3—pyrrolyl
	610	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3–Isoxazolyl
25 [	611	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Methyl-3-isoxazolyl
	612	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isoxazolyl
[	613	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
	614	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5–Dihydro–3–isoxazolyl
30	615	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	616	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	617	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
3.	618	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Isoxazolyl
35	619	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methyl-4-isoxazolyl
	620	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-4-isoxazolyl
	621	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5Cyclopropyl-4-isoxazolyl
40	622	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Phenyl-4-isoxazolyl
30	623	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5—Dimethyl—4-isoxazolyl
	624	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5—Dihydro-4–isoxazolyl
	625	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Methyl—4,5—dihydro—4—isoxazolyl
45	626	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	627	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	628	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Isoxazolyl

	Nr.	Xi	Het
	629	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isoxazolyl
	630	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Methyl-5-isoxazolyl
5	631	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,4–Dimethyl–5–isoxazolyl
	632	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro-5-isoxazolyl
	633	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
. [	634	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
10	635	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	636	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Isothiazolyl
	637	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Methyl-3-isothiazolyl
15	638	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-3-isothiazolyl
	639	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4—Isothiazolyl
	640	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methyl-4-isothiazolyl
	641	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-4-isothiazolyl
20	642	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5—Isothiazolyl
	643	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Methyl-5-isothiazolyl
	644	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Methyl-5-isothiazolyl
	645	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2Oxazolyl
25	646	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Oxazolyl
	647	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Oxazolyl
	648	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2—Thiazolyl
	649	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Thiazolyl
30	650	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Thiazolyl
	651	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3-Pyrazolyl
	652	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Pyrazolyl
35	653	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methyl-3-pyrazolyl
33	654	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1Methyl-4-pyrazolyl
	655	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methyl-5-pyrazolyl
	656	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2—Imidazolyl
40	657	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1-Methyl-2-imidazolyl
	658	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
	659	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
	660	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
45	661	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
	662	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[1,2,4]-3-triazolyl
	663	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[1,2,3]—4 triazolyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	664	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2–Pyridyl
	665	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Chlor-2-pyridyl
5	666	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Methoxy-2-pyridyl
	667	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
	668	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3–Pyridyl
	669	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Chlor-3-pyridyl
10	670	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Methoxy-3-pyridyl
	671	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4–Pyridyl
	672	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Chlor-4-pyridyl
15	673	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Methoxy-4-pyridyl
	674	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2–Ethoxy–4–pyridyl
	675	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Methylthio-4-pyridyl
	676	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-Trifluormethyl-5-pyridyl
20	677	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2–Pyrimidinyl
	678	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3–Pyrimidinyl
	679	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4–Pyrimidinyl
	680	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2—Pyrazinyl
25	681	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3—Pyridazinyl
	682	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Pyridazinyl
	683	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-(2 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
	684	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2-(6 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
30	685	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-(6H-1,3-oxazinyl)
	686	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6–(6H–1,3–oxazinyl)
	687	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[1,3,5]–2–Triazinyl
35	688	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[1,2,4]–3–Triazinyl
35	689	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[1,2,4]-5-Triazinyl
	690	CHOSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	[1,2,4]6-Triazinyl
	691	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	Oxiranyl
40	692	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-2-oxiranyl
	693	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Oxetanyl
	694	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3Hydroxy-3-methyl-2-oxetanyl
	695	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
45	696	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Hydroxy-3-propyl-2-oxetanyl
	697	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3Hydroxy-3butyl-2-oxetanyl
	698	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	699	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	700	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
5	701	CH₂CH₂	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
	702	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3—Trimethylsilyloxy-3—methyl-2-oxetanyl
	703	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	704	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3—Trimethylsilyloxy—3—propyl—2—oxetanyl
10	705	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
	706	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Oxetanyl
	707	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2–Furyl
15	708	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5–Dihydro–2–furyl
	709	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2,3-Dihydro-2-furyl
	710	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3–Furyl
	711	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5-Dihydro-3furyl
20	712	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2,3—Dihydro—3—furyl
	713	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2—Thienyl
	714	CH₂CH₂	4,5-Dihydro-2thienyl
	715	CH₂CH₂	2,3—Dihydro—2—thienyl
25	716	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Chlor-2-thienyl
	717	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-2-thienyl
	718	CH2CH2	3—Thienyl
	719	CH2CH2	4,5-Dihydro-3-thienyl
30	720	CH₂CH₂	2,3-Dihydro-3-thienyl
	721	CH₂CH₂	2–Pyπolyl
	722	CH2CH2	2,5—Dihydro–2—pyrrolyl
35	723	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3–Pyπolyl
33	724	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2,5—Dihydro–3pyrrolyl
	725	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Isoxazolyi
	726	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Methyl-3-isoxazolyl
40	727	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-3-isoxazolyl
	728	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5-Dimethyl-3-isoxazolyl
	729	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5—Dihydro–3—isoxazolyl
	730	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
45	731	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	732	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5–Dimethyl–4,5–dihydro–3–isoxazolyl
	733	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4—Isoxazolyl

	Nr.	Χ <sup>ĺ</sup>	Het
	734	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4-isoxazolyl
	735	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4-isoxazolyl
5	736	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
	737	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5—Phenyl—4—isoxazolyl
	738	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3,5—Dimethyl—4—isoxazolyl
1.0	739	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5—Dihydro-4-isoxazolyl
10	740	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	741	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	742	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3,5—Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
15	743	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5Isoxazolyl
	744	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-5-isoxazolyl
	745	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Methyl-5-isoxazolyl
	746	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3,4—Dimethyl—5—isoxazolyl
20	747	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4,5—Dihydro–5—isoxazolyl
	748	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	749	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	750	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
25	751	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3—Isothiazolyl
	752	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Methyl-3-isothiazolyl
	753	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-3-isothiazolyl
	754	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4—Isothiazolyl
30	755	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-4-isothiazolyl
	756	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-4-isothiazolyl
	757	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Isothiazolyl
35	758	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Methyl-5-isothiazolyl
35	759	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Methyl-5-isothiazolyl
	760	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Oxazolyl
	761	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Oxazolyl
40	762	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Oxazolyl
	763	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Thiazolyl
	764	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4—Thiazolyl
	765	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Thiazolyl
45	766	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Pyrazolyl
:	767	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Pyrazolyl
	768	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	l-Methyl-3-pyrazolyl

	Nr.	χſ	Het
	769	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	l-Methyl-4-pyrazolyl
	770	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	l-Methyl-5-pyrazolyl
5	771	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Imidazolyl
	772	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	l-Methyl-2-imidazolyl
	773	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
	774	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
10	775	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
	776	CH₂CH₂	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
	777	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	[1,2,4]-3-triazolyl
15	778	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	[1,2,3] <del>-4-triazoly</del> l
	779	CH₂CH₂	2-Pyridyl
	780	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	6-Chlor-2-pyridyl
	781	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	6-Methoxy-2-pyridyl
20	782	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
	783	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3–Pyridyl
	784	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Chlor-3-pyridyl
	785	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Methoxy-3-pyridyl
25	786	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4–Pyridyl
	<b>78</b> 7	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Chlor-4-pyridyl
	788	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Methoxy-4-pyridyl
	789	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2–Ethoxy–4–pyridyl
30	790	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Methylthio-4-pyridyl
	791	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2—Trifluormethyl—5—pyridyl
	792	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl
[	793	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Pyrimidinyl
35	794	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4-Pyrimidinyl
	795	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-Pyrazinyl
	796	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	3-Pyridazinyl
40	797	CH₂CH₂	4-Pyridazinyl
- 0	798	CH₂CH₂	2–(2 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
	799	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	2-(6H-1,3-oxazinyl)
	800	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	4–(6 <i>H</i> –1,3–oxazinyl)
45	801	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	6-(6H-1,3-oxazinyl)
	802	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	[1,3,5]-2-Triazinyl
	803	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	[1,2,4]-3-Triazinyl

	Nг.	Χſ	Het
	804	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	[1,2,4]—5—Triazinyl
	805	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	[1,2,4]–6–Triazinyl
5	806	-c≡c-	Oxiranyl
	807	-C=C	3—Methyl—2—oxiranyl
	808	-C≡C	2-Oxetanyl
	809	CEC	3—Hydroxy—3—methyl—2—oxetanyl
10	810	-C≡C-	3-Hydroxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	811	-c≡c-	3—Hydroxy—3—propyl—2—oxetanyl
	812	C≣C	3—Hydroxy3-butyl-2-oxetanyl
15	813	-C≣C-	3-Methoxy-3-methyl-2-oxetanyl
	814	C≣C	3-Methoxy-3-ethyl-2-oxetanyl
	815	C≡C	3-Methoxy-3-propyl-2-oxetanyl
	816	-C≡C	3-Methoxy-3-butyl-2-oxetanyl
20	817	-C≣C-	3-Trimethylsilyloxy-3-methyl-2-oxetanyl
	818	-c≡c-	3—Trimethylsilyloxy—3—ethyl—2—oxetanyl
	819	-C≡C-	3-Trimethylsilyloxy-3-propyl-2-oxetanyl
	820	-c≡c-	3-Trimethylsilyloxy-3-butyl-2-oxetanyl
25	821	-c≡c-	3-Oxetanyl
	822	-c≡c-	2–Furyl
	823	-C≣C-	4,5-Dihydro-2-furyl
	824	—C≡C—	2,3—Dihydro–2–furyl
30	825	—C≣C—	3—Furyl
	826	-c≡c-	4,5—Dihydro–3–furyl
	827	-c≡c-	2,3—Dihydro–3–furyl
3.5	828	-CEC-	2—Thienyl
35	829	-c≡c-	4,5-Dihydro-2-thienyl
	830	-C≣C-	2,3-Dihydro-2-thienyl
	831	-CEC-	5-Chlor-2-thienyl
40	832	-C≡C-	5-Methyl-2-thienyl
	833	-c≡c-	3—Thienyl
	834	-C≡C-	4,5-Dihydro-3-thienyl
ļ	835	—C≣C—	2,3-Dihydro-3-thienyl
45	836	-C≣C-	2–Pyrrolyl
	837	_C≡C—	2,5–Dihydro–2–pytrolyl
	838	-c≅c-	3–Pyrrolyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	839	-c≡c-	2,5–Dihydro–3–pyrrolyl
!	840	-c≡c-	3–Isoxazolyl
5	841	-c≡c-	4-Methyl-3-isoxazolyl
	842	-c=c-	5-Methyl-3-isoxazolyl
	843	-c≡c-	4,5–Dimethyl–3–isoxazolyl
10	844	—C≣C—	4,5–Dihydro–3–isoxazolyl
10	845	-c≡c-	4-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	846	-c≡c-	5-Methyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
	847	C≡C-	4,5-Dimethyl-4,5-dihydro-3-isoxazolyl
15	848	-C≡C-	4—Isoxazolyl
	849	-C≣C-	3-Methyl-4-isoxazolyl
	850	-C≡C-	5-Methyl-1-isoxazolyl
	851	—C≣C—	5-Cyclopropyl-4-isoxazolyl
20	852	—C≡C—	5-Phenyl-4-isoxazolyl
	853	—C≣C—	3,5—Dimethyl—4—isoxazolyl
	854	—C≣C—	4,5—Dihydro—4—isoxazolyl
	855	-C≡C-	3-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
25	856	-C≡C-	5-Methyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	857	—C≣C—	3,5-Dimethyl-4,5-dihydro-4-isoxazolyl
	858	—C≡C—	5-Isoxazolyl
	859	-C≡C-	3-Methyl-5-isoxazolyl
30	860	-C=C-	4-Methyl-5-isoxazolyl
	861	C≣C	3,4-Dimethyl-5-isoxazolyl
	862	-C≡C-	4,5–Dihydro–5–isoxazolyl
35	863	-C≡C-	3-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
رد	864	-C≣C-	4-Methyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	865	-C≡C-	3,4-Dimethyl-4,5-dihydro-5-isoxazolyl
	866	-C≡C-	3—Isothiazolyl
40	867	-CEC-	4-Methyl-3-isothiazolyl
	868	—C≣C—	5-Methyl-3-isothiazolyl
	869	-C≡C-	4—Isothiazolyl
	870	-C≡C-	3-Methyl-4-isothiazolyl
45	871	<u>-C≡C-</u>	5—Methyl—4—isothiazolyl
	872	-C≡C-	5—Isothiazolyl
	873	-C≣C-	3-Methyl-5-isothiazolyl

	Nr.	X <sup>1</sup>	Het
	874	-C≡C	4-Methyl-5-isothiazolyl
	875	-C≡C-	2–Oxazolyl
5	876	-C≡C-	4-Oxazoly!
	877	C≡C	5-Oxazolyl
	878	-C≡C-	2-Thiazolyl
	879	—C≣C—	4-Thiazolyl
10	880	C≡C	5Thiazolyl
	881	-C≡C-	3Pyrazolyl
	882	C≣C	4–Pyrazolyl
15	883	-C≡C-	1Methyl-3-pyrazolyl
-7	884	-C≡C-	1-Methyl-4-pyrazolyl
	885	-C≡C-	l-Methyl-5-pyrazolyl
	886	—C≡C—	2–Imidazolyl
20	887	—C≣C—	1-Methyl-2-imidazolyl
	888	—C≣C—	5-Methyl-[1,3,4]-2-oxadiazolyl
Ī	889	—C≣C—	5-Methyl-[1,2,4]-3-oxadiazolyl
	890	—C≡C—	5-Methyl-[1,3,4]-2-thiadiazolyl
25	891	-C≡C-	5-Methyl-[1,2,4]-3-thiadiazolyl
Ī	892	C≡C	[1,2,4]–3–triazolyl
	893	-c≡c-	[1,2,3] 4 triazolyl
	894	—c≡c—	2–Pyridyl
30	895	—C≣C—	6-Chlor-2-pyridyl
	896	—C≣C—	6-Methoxy-2-pyridyl
Ī	897	c≡c	6-Trifluormethyl-2-pyridyl
	898	-C≡C-	3–Pyridyl
35	899	-c≡c-	2-Chlor-3-pyridyl
	900	-C≡C-	2-Methoxy-3-pyridyl
	901	-CEC-	4–Pyridyl
40	902	-c≡c-	2-Chlor-4-pyridyl
30	903	-c≡c-	2-Methoxy-4-pyridyl
	904	-c≡c-	2-Ethoxy-4-pyridyl
	905	-C≣C	2-Methylthio-4-pyridyl
45	906	-C≡C-	2—Trifluormethyl—5—pyridyl
	907	-c≡c-	2Pyrimidinyl
	908	-CEC-	3-Pyrimidinyl

	Nr.	X1	Het
	909	-c≡c	4-Pyrimidinyl
	910	-c≡c	2-Pyrazinyl
5	911	-CEC-	3—Pyridazinyl
	912	-c=c-	4-Pyridazinyl
	913	-c≡c	2-(2H-1,3-oxazinyl)
10	914	-c≡c-	2-(6H-1,3-oxazinyl)
10	915	-c≅c-	4-(6 <i>H</i> -1,3-oxazinyl)
	916	-c≡c-	6-(6H-1,3-oxazinyl)
	917	-c≡c-	[1,3,5]–2–Triazinyl
15	918	-c≡c-	[1,2,4]-3-Triazinyl
	919	-c≡c-	[1,2,4]–5–Triazinyl
	920	-C≡C-	[1,2,4]–6–Triaziny1

Die folgenden Tabellen 1 - 36 basieren auf den 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dionen der Formel Ib

5

10

Ib

Tabelle 1: Verbindungen 1.1-1.920

- 15 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Chlor,  $R^2$  Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 20 Tabelle 2: Verbindungen 2.1-2.920Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  Chlor,  $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^8$ ,  $\mathbb{R}^9$ ,  $\mathbb{R}^{10}$  und  $\mathbb{R}^{11}$  Wasserstoff bedeutet und die Substituenten  $\mathbb{X}^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

25

Tabelle 3: Verbindungen 3.1-3.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  Chlor,  $\mathbb{R}^2$  Trifluormethyl,  $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^8$ ,  $\mathbb{R}^9$ ,  $\mathbb{R}^{10}$  und  $\mathbb{R}^{11}$  Wasserstoff bedeutet und die Substituenten  $\mathbb{X}^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils 30 einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 4: Verbindungen 4.1-4.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  Methyl,  $\mathbb{R}^2$  Chlor,  $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^8$ ,  $\mathbb{R}^9$ ,  $\mathbb{R}^{10}$  und  $\mathbb{R}^{11}$  Wasserstoff bedeutet und die

35 Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 5: Verbindungen 5.1-5.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  40 Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 6: Verbindungen 6.1-6.920

45 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Trifluormethyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff bedeutet und

54

die Substituenten  $\mathbf{X}^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 7: Verbindungen 7.1-7.920

- 5 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Chlor,  $R^2$  Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff,  $R^8$  und  $R^9$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 10 Tabelle 8: Verbindungen 8.1-8.920Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  und  $R^2$  Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff,  $R^8$  und  $R^9$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 9: Verbindungen 9.1-9.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R<sup>1</sup> Chlor, R<sup>2</sup> Trifluormethyl, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> Wasserstoff, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> Methyl bedeutet und die Substituenten X<sup>1</sup> und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 10: Verbindungen 10.1-10.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$ Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff,  $R^8$  und  $R^9$  Methyl bedeutet 25 und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 11: Verbindungen 11.1-11.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R<sup>1</sup> Methyl, R<sup>2</sup>

30 Methylsulfonyl, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> Wasserstoff, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> Methyl bedeutet und die Substituenten X<sup>1</sup> und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 12: Verbindungen 12.1-12.920

- 35 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R<sup>1</sup> Methyl, R<sup>2</sup> Trifluormethyl, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> Wasserstoff, R<sup>8</sup> und R<sup>9</sup> Methyl bedeutet und die Substituenten X<sup>1</sup> und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 40 Tabelle 13: Verbindungen 13.1-13.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R $^1$  Chlor, R $^2$  Methylsulfonyl, R $^6$ , R $^7$ , R $^8$  und R $^9$  Wasserstoff, R $^{10}$  und R $^{11}$  Methyl bedeutet und die Substituenten X $^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 14: Verbindungen 14.1-14.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  und  $R^2$  Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  Wasserstoff,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $X^1$ - und Het für jede einzelne Verbindung jeweils 5 einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 15: Verbindungen 15.1-15.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Chlor,  $R^2$  Trifluormethyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  Wasserstoff,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl be-

10 deutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 16: Verbindungen 16.1-16.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  Methyl,  $\mathbb{R}^2$ 

15 Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  Wasserstoff,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 17: Verbindungen 17.1-17.920

- 20 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  Wasserstoff,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 25 Tabelle 18: Verbindungen 18.1-18.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Trifluormethyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  und  $R^9$  Wasserstoff,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

30

Tabelle 19: Verbindungen 19.1-19.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Chlor,  $R^2$  Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet, die  $CR^8R^9$ -Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten  $X^1$  und Het für

35 jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 20: Verbindungen 20.1-20.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> Chlor.

40  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet, die  $CR^8R^9$ -Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 21: Verbindungen 21.1-21.920

45 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Chlor,  $R^2$  Trifluormethyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet, die  $CR^8R^9$ -Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede

einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 22: Verbindungen 22.1-22.920

- 5 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Methyl bedeutet, die  $CR^8R^9$ -Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 10 Tabelle 23: Verbindungen 23.1-23.920
  Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R¹ Methyl, R²
  Methylsulfonyl, R6, R7, R¹0 und R¹¹ Methyl bedeutet, die CR®R9-Einheit eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten X¹ und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent15 sprechen.

Tabelle 24: Verbindungen 24.1-24.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  Methyl,  $\mathbb{R}^2$  Trifluormethyl,  $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^{10}$  und  $\mathbb{R}^{11}$  Methyl bedeutet, die  $\mathbb{CR}^8\mathbb{R}^9$ -Einheit 20 eine Gruppe C=O bildet und die Substituenten  $\mathbb{X}^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspre-

Tabelle 25: Verbindungen 25.1-25.920

chen.

- 25 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff,  $R^9$  Methyl bedeutet, die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 30 Tabelle 26: Verbindungen 26.1-26.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  Chlor,  $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^8$ ,  $\mathbb{R}^{10}$  und  $\mathbb{R}^{11}$  Wasserstoff,  $\mathbb{R}^9$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $\mathbb{X}^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 27: Verbindungen 27.1-27.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $\mathbb{R}^1$  Chlor,  $\mathbb{R}^2$  Trifluormethyl,  $\mathbb{R}^6$ ,  $\mathbb{R}^7$ ,  $\mathbb{R}^8$ ,  $\mathbb{R}^{10}$  und  $\mathbb{R}^{11}$  Wasserstoff,  $\mathbb{R}^9$  Methyl bedeutet und die Substituenten  $\mathbb{X}^1$  und Het für jede einzelne Verbindung 40 jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 28: Verbindungen 28.1-28.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$ Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff,  $R^9$  Methyl bedeutet und 45 die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

57

Tabelle 29: Verbindungen 29.1-29.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R<sup>1</sup> Methyl, R<sup>2</sup> Methylsulfonyl, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>10</sup> und R<sup>11</sup> Wasserstoff, R<sup>9</sup> Methyl bedeutet und die Substituenten X<sup>1</sup> und Het für jede einzelne Ver-

5 bindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 30: Verbindungen 30.1-30.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Trifluormethyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$ ,  $R^{10}$  und  $R^{11}$  Wasserstoff,  $R^9$  Methyl bedeu-

10 tet und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 31: Verbindungen 31.1-31.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R1 Chlor, R2

- 15 Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  und  $R^{10}$  Wasserstoff bedeutet,  $R^8$  und  $R^{11}$  zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.
- 20 Tabelle 32: Verbindungen 32.1-32.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  und  $R^2$  Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  und  $R^{10}$  Wasserstoff bedeutet,  $R^8$  und  $R^{11}$  zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspre-25 chen.

Tabelle 33: Verbindungen 33.1-33.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Chlor,  $R^2$  Trifluormethyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  und  $R^{10}$  Wasserstoff bedeutet,  $R^8$  und  $R^{11}$ 

30 zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 34: Verbindungen 34.1-34.920

35 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Chlor,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  und  $R^{10}$  Wasserstoff bedeutet,  $R^8$  und  $R^{11}$  zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten  $X^1$  und Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

40

Tabelle 35: Verbindungen 35.1-35.920 Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der  $R^1$  Methyl,  $R^2$  Methylsulfonyl,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  und  $R^{10}$  Wasserstoff bedeutet,  $R^8$  und  $R^{11}$  zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten  $X^1$  und

45 Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Tabelle 36: Verbindungen 36.1-36.920

Verbindungen der allgemeinen Formel Ib, in der R<sup>1</sup> Methyl, R<sup>2</sup> Trifluormethyl, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> Wasserstoff bedeutet, R<sup>8</sup> und R<sup>11</sup>

zusammen eine Methylengruppe bilden und die Substituenten X<sup>1</sup> und
5 Het für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der 10 reinen Isomeren - als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser 15 Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen I bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen 20 eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec.

- 25 rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoinensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis
- 30 guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot
- 35 esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum
- 40 tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera, Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die 45 durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

59

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die

5 herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post directed, lay-by).

10

Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen,

15 Öldispersionen, Pasten. Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

20

Als inerte Zusatzstoffe kommen im wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromati-

25 sche Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon oder stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon oder Wasser.

30

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die

35 substituierte 2-Benzoylcyclohexan-1,3-dione als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder

40 Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-,

45 Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta-

60

und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether. Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit
Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der
Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxy5 ethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder
Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether
oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykolether10 acetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose
in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen 15 Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselssäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, 25 Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentration der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die For30 mulierungen enthalten im allgemeinen 0,001 bis 98 Gew.-%,
vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, minestens eines Wirkstoffs. Die
Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %,
vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

- 35 Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:
- 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem
  40 Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000

61

Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

20 Gewichtsteile der Verbindung Nr.20.39 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

IV 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl25 naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigen Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser enthält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

V 3 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VI 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 20.39 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfon40 säure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

62

VII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 20.39 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Ricinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

VIII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 20.39 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol ® EM 31 (nicht ionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl). Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die substituierte 2-Benzoylcyclohe15 xan-1,3-dione mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, (Het)-Aryloxyalkan20 säure und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazone, 2-Aroyl-1,3-cyclohexandione, Hetaryl-Aryl-Ketone, Benzylisooxazolidinone, Meta-CF3-phenylderivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclo-

hexan-1,3-dionderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren
25 Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline,
Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren
und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole,
Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide,
Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- oder Heteroaryloxyphenoxy-

30 propionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole,
Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone,
Triazolinone, Triazolcarboxamide, Uracile in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder 40 phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

5 Nachfolgend werden die Synthesen einiger Edukte und Produkte beschrieben.

2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonylmethyl-(5,5-dimethyl-cyclohexan-1,3-dion)-methanon

Stufe a: 2-Chlor-3-(2-nitroethenyl)-4-sulfonylmethyl-benzoesäuremethylester

- 50 g (0,18 mol) 2-Chlor-3-formyl-4-sulfonylmethyl-benzoesäure15 methylester, 220 g (3,6 mol) Nitromethan, 216 g (3,6 mol) Eisessig und 7 g (91 mmol) Ammoniumacetat werden unter Ausschluß von
  Luftfeuchtigkeit bei 85°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird auf 2
  l dest. Wasser gegossen und mit Diethylether extrahiert. Die
  organische Phase wird mit gesättigter, wäßriger Natriumhydrogen-
- 20 carbonat-Lösung gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird aus n-Hexan/Essigsäureethylester umkristallisiert. Ausbeute: 13,1 g, Fp. 147 150°C
- 25 Stufe b: 2-Chlor-3-(2-nitroethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoesäuremethylester
  - 19,4 g (61 mmol) 2-Chlor-3-(2-nitroethenyl)-4-sulfonylmethyl-ben-zoesäuremethylester und 121 g Kieselgel 60 werden in 180 ml
- 30 2-Propanol und 970 ml Chloroform suspendiert und bei Raumtemp. mit 3.5 g (94 mmol) Natriumborhydrid behandelt. Das Reaktionsgemisch wird filtriert, das Filtrat mit Dichlormethan/ Methanol 1:1 (v/v) gewaschen und die organische Phase i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Ausbeute: 19,5 g;  $^1\text{H-NMR}$ ,  $\delta$  [ppm], CDCl3: 3.2 (s), 35 3,9 (m), 4,0 (s), 4,7 (m), 7,8 (d), 8,1 (d)
  - Stufe c: 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-4-sulfonyl-methyl-benzoesäuremethylester
- 40 Eine Lösung aus 2,8 g (23 mmol) Phenylisocyanat in 50 ml Toluol wird bei Raumtemp. mit Ethylen begast. Dazu wird eine Lösung aus 3,7 g (11 mmol) 2-Chlor-3-(2-nitroethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoesäuremethylester und 0,5 ml Triethylamin in 100 ml Toluol gegeben. Das Reaktionsgemisch wird in 300 ml Diethylether aufgenom-
- 45 men, mit dest. Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird an Kieselgel 60 mit Cyclohexan/Essigsäureethylester gerei-

nigt. Ausbeute: 1.0 g;  $^{1}H$ -NMR,  $\delta$  [ppm], CDCl3: 3,1 (t), 3,2 (s), 4,0 (s), 4,4 (t), 4,5 (s), 7,7 (d), 8,1 (d)

Stufe d: 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoesäure

Eine Lösung aus 2,3 g (7 mmol) 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxa-zolylmethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoesäuremethylester in 40 ml Tetrahydrofuran wird bei 5°C mit 0,3 g (13 mmol) Lithiumhydroxid 10 behandelt. Das Reaktionsgemisch wird in 300 ml Diethylether aufgenommen und mit 10 %iger, wäßriger Salzsäure-Lösung auf pH 1 eingestellt. Die wäßrige Phase wird mit Diethylether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit.

15 Ausbeute 1,7 g;  ${}^{1}H$ -NMR,  $\delta$  [ppm], DMSO-d<sub>6</sub>: 3,0 (t), 3,3 (s), 4,2 (t), 4,3 (s), 7,8 (d), 8,1 (d)

Stufe e: 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonylmethyl-(5,5-dimethyl-cyclohexan-1,3-dion)methanon (Tabelle 7, Beispiel 39)

Eine Lösung aus 1,0 g (3 mmol) 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxa-zolylmethyl)-4-sulfonylmethyl-benzoesäure und 440 mg (3 mmol) Dimedon in 50 ml Acetonitril wird bei  $40^{\circ}$ C mit 0,8 g (3.8 mmol)

- 25 N,N-Dicyclohexylcarbodiimid behandelt. Nach abgeschlossener Reaktion (DC-Kontrolle) gibt man 310 mg (3 mmol) Trimethylsilylcyanid und 950 mg (9 mmol) Triethylamin zu. Das Reaktionsgemisch wird filtriert und i. Vak. vom Lösungsmittel befreit. Das Rohprodukt wird an Kieselgel 60 mit Toluol/ Tetrahydrofuran oder Dichlor-30 methan/Toluol gereinigt. Ausbeute 600 mg; Fp. 168 173°C
  - Die im folgonden beschriebenen Werbindung wurden anglog zu de

Die im folgenden beschriebenen Verbindung wurden analog zu den oben angegebenen Arbeitsvorschriften dargestellt.

35 2-Chlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonyl-methyl-(cyclohexan-1,3-dion)-methanon (Tabelle 1, Beispiel 39) Fp. 70 - 74°C

2-Ghlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-4-sulfonyl-40 methyl-(3,3,6,6-tetramethyl-cyclohexan-1,3,5-trion)-methanon (Tabelle 19, Beispiel 39)
Fp. 168 - 173°C

2,4-Dichlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylmethyl)-phenyl)-(5,5-di-45 methyl-cyclohexan-1,3-dion)-methanon (Tabelle 8, Beispiel 39) Fp. 56 - 64°C

2,4-Dichlor-3-((4,5-dihydro-3-isoxazolylme-thyl)-phenyl)-(3,3,6,6-tetramethyl-cyclohexan-1,3,5-trion)-methanon (Tabelle 20, Beispiel 39)

Fp. 196 - 202°C

5

2,4-Dichlor-3-((3-(5H-furanon)methyl)phenyl)-2,2,4,4,-tetramethyl-1,3,5-cyclohexantrion)methanon

Stufe a: 2,4-Dichlor-3-(3-(5H-furanon)methyl)benzoesäure

Die Lösung von 13 g (0,038 mol)

2,4-Dichlor-3-(3-furyl)hydroxymethylbenzoesäure-tertbutylester und 1,8 g p-Toluolsulfonsäure in 370 ml Toluol
werden 6h refluxiert. Anschließend wird auf 100 ml 10 %

Natronlauge gegeben und mit Essigester extrahiert. Die
wässrige Phase wird mit Salzsäure angesäuert und mit
Essigester mehrmals extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser gewaschen, getrocknet
und eingeengt. Es verbleiben 4,8 g (45 %) der Titelverbindung Fp.196°C

20

Stufe b: 2,4-Dichlor-3-((3-(5H-furanon)methyl)phenyl)-(2,2,4,4-te-tramethyl-1,3,5-cyclohexantrion)methanon

25

30

35

1,6 g (0,0056 mol) der so erhaltenen Säure, 1,0 g (0,0056 mol) 2,2,4,4-tetramethyl-1,3,5-cyclohexantrion und 1,15 g (0,0056 mol) Dicyclohexylcarbodiimid werden bei Raumtemperatur in 15 ml Acentonitril gerührt. Anschließend werden 1,13 g (0,012 mol) Triethylamin und 0,1 ml Trimethylsilylcyanid zugegeben und weitere 12h bei Raumtemperatur belassen.

40

45

Der Reaktionsansatz wird mit 50 ml Essigester verdünnt, mit 50 ml Natriumcarbonat-Lösung versetzt und der entstandene Niederschlag verworfen. Die organische Phase wird abgetrennt, getrocknet und eingeengt. Der erhaltene Rückstand wird an einer Kieselgelsäule chromatographiert (Cyclohexan/Essigester 1:10). Man erhält 120 mg (5 %) der Titelverbindung.

(charakteristische 13-C-NMR-Daten: 209.1, 197.6, 195.9, 195.1, 173.4, 145.6, 137.7, 136.2, 134.7, 131.3, 130.6, 128.6, 126.2, 110.2, 70.5, 27.7,

In analoger Weise wurde hergestellt:

2,4-Dichlor-3-((3-(5H-furanon)methyl)phenyl)-(1,3-cyclo-

hexandion-2yl-)methanon
Schmelzpunkt: 119-121

Tabelle 37

15

5

$$\begin{array}{c|c} CI & \text{Het} \\ \\ R^6 & O \\ \\ R^7 & R^8 \\ \\ R^9 & R^{10} \end{array}$$

25

20

	Nr.	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	Het	Fp. [°C]	1 <sub>H</sub> . NMR [ppm]
30	37.1	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	4,5-Dihydro- 3-isoxazolyl	64	
	37.2	CH <sub>3</sub>	CH3	C=	=0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4,5-Dinydro- 3-isoxazolyl	202	

Tabelle 38

35

$$R^6$$
 $R^7$ 
 $R^8$ 
 $R^9$ 
 $R^{11}$ 
 $R^{11}$ 

45

67

	Nr.	Re	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R11	Het	Fp.	NMR [ppm]
_	38.1	Н	Н	Н -	Н	Н	Н	4,5-Dihydro- 3-isoxazolyl	74	
5	38.2	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	4,5-Dihydro- 3-isoxazolyl	96	
	38.3	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	4,5-Dihydro- 5-methyl-3- isoxazolyl	119	
10	38.4	Н	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Н	Н	3-Isoxazolyl	92	
	38.5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C	=0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro- 3-isoxazolyl	173	
15	38.6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C	=0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4,5-Dihydro- 5-chlor- methyl-3- isoxazolyl	84	

Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der substituierte 2-Benzoylcyclohe-20 xan-1,3-dione der Formel I ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastiktöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0% Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach 25 Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um 30 Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

35

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0.5 bzw. 0.25 kg/ha a. S.

45 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt,

und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 5 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich 10 aus folgenden Arten zusammen:

	<u>Lateinischer Name</u>	Deutscher Name	Englischer Name
	Chenopodium album	Weißer Gänsefuß	lambsquarters
			(goosefoot)
15	Setaria viridis	Grüne Borstenhirse	green foxtail
	Sinapis alba	Weißer Senf	white mustard
	Solanum nigrum	Schwarzer Nacht-	black nightshade
		schatten	

20

Herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

Oben genannte Unkräuter werden von der Verbindung 37.2 im Nach-35 auflauf bei Aufwandmengen von 0,5 bzw. 0,25 kg/ha a.S. sehr gut bekämpft.

## Patentansprüche

1. 2-Benzyol-cyclohexan-1,3-dione der Formel I

 $Q \xrightarrow{X^1} \xrightarrow{\text{Het}}$ 

in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R1, R2 Wasserstoff, Mercapto, Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $-OR^3$ ,  $-OCOR^3, -OSO_2R^3, -S(O)_nR^3, -SO_2OR^3, -SO_2N(R^3)_2, \\ -NR^3SO_2R^3 \text{ oder } -NR^3COR^3;$ 

Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl, Phenyl oder Phenyl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl; wobei die genannten Alkylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können:

Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, R³, -OR³, -SR³,
-N(R³)2, =NOR³, -OCOR³, -SCOR³, -NR³COR³, -CO2R³,
-COSR³, -CON(R³)2, C1-C4-Alkyliminooxy, C1-C4-Alkoxy-amino, C1-C4-Alkylcarbonyl, C1-C4-Alkoxy-C2-C6-alkoxy-carbonyl, C1-C4-Alkylsulfonyl, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Phenyl, Benzyl, Hetaryl, Phenoxy, Benzyloxy und Hetaryloxy, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits substituiert sein können;

**40** n 0, 1 oder 2;

Q ein gegebenenfalls substituierter, in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring;

45  $x^1 \qquad \text{eine geradkettige oder verzweigte $C_1$-$C_6$-$Alkylen-,} \\ \text{eine $C_2$-$C_6$-$Alkenylen- oder eine $C_2$-$C_6$-$Alkinylenkette,} \\ \text{wobei die genannten Alkylen-, Alkenylen- oder Alkiny-}$ 

lenreste	partiell	halogeniert sein können und/oder
eine bis	drei der	folgenden Gruppen tragen können:

 $-OR^4$ ,  $-OCOR^4$ ,  $-OCONHR^4$  oder  $-OSO_2R^4$ 

5

und wobei die genannten Alkenylenreste ausgenommen sind, bei denen sich die Doppelbindung in  $\alpha,\beta$ -Position zum Phenylring befindet und bei denen Het über die  $\beta$ -Position an die Doppelbindung gebunden ist;

10

 $R^4$ 

Het

Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl, Phenyl, Phenyl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, wobei die genannten Alkyl-, Alkenyl oder Alkinylreste partiell oder vollständig halogeniert sein können und/ oder durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

20

15

Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl-oxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy;

25

eine drei- bis sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte, heterocyclische Gruppe oder eine drei- bis sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe:

30

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel,

35

wobei die gennante heterocyclische oder heteroaromatische Gruppe partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder durch  $\mathbb{R}^5$  substituiert sein kann;

. **4**0  $\mathbb{R}^5$ 

Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Amino, Cyano, Nitro, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyloxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy, wobei die Alkylreste in allen Fällen jeweils durch einen oder mehrere der folgenden Reste substituiert sein können:

5

30

Cyano, Formyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Dialkylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyloxy,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I nach Anspruch 1, in der Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dion-Ring der Formel II

15 R<sup>6</sup> R<sup>7</sup> R<sup>10</sup> R<sup>11</sup> C

II

ist, wobei  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^9$  und  $R^{11}$  für Wasserstoff oder  $C_1 - C_4 - Alkyl$  stehen;

 $R^8$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_3$ - $C_4$ -Cycloalkyl steht, wobei die beiden letztgenannten Gruppen einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können:

Halogen,  $C_1-C_4$ -Alkylthio oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy;

oder

für Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl,
Tetrahydropyran-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl,
Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl,
1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl
oder 1,3-Dithian-2-yl steht, wobei die 6 letztgenannten Reste durch einen bis drei C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylreste substituiert sein können;

45  $R^{10}$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl steht;

oder

 $R^8$  und  $R^{11}$  gemeinsam eine p-Bindung oder einen drei- bis sechsgliedrigen carbocyclischen Ring bilden;

5

oder

die CR8R9-Einheit durch C=O ersetzt sein kann.

10

- 3. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel I nach Anspruch 1 oder 2, in der
- Nitro, Halogen, Cyano, Rhodano,  $C_1-C_6-Alkyl$ ,  $C_1-C_6-Halogenalkyl, \ C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, \\ C_2-C_6-Alkenyl, \ C_2-C_6-Alkinyl, \ -OR^3 \ oder \ -S(O)_nR^3 \ bedeutet;$
- 20  $R^2$  für Wasserstoff oder einen wie voranstehend unter  $R^1$  genannten Rest steht.
  - 4. 4-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel Ia nach einem der Ansprüche 1 bis 3,

25

$$Q$$
 $R^1$ 
 $X^1$ 
 $R^2$ 
Het

30

Ιa

in der die Substituenten  $\mathbb{R}^1$ ,  $\mathbb{R}^2$ ,  $\mathbb{Q}$ ,  $\mathbb{X}^1$  und Het die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung haben.

- 5. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel Ia nach Anspruch 4, in der  $X^1$  für eine  $C_1$ - $C_2$ -Alkylen oder  $C_2$ -Alkinylenkette steht.
- 6. 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dione der Formel Ia nach einem der Ansprüche 1 bis 5, in der Het eine fünf- oder sechsgliedrige, teilweise oder vollständig gesättigte heterocyclische oder eine fünf- oder sechsgliedrige heteroaromatische Gruppe mit bis zu drei Heteroatomen ausgewählt aus der Gruppe

15

30

Stickstoff, Sauerstoff oder Schwefel

steht.

Verfahren zur Herstellung von 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dionen der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6, dadurch gekennzeichnet, daß man ein gegebenenfalls substituiertes Cyclohexan-1,3-dion Q mit einer aktivierten Carbonsäure IIIa oder mit einer Carbonsäure IIIb,

wobei die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X<sup>1</sup> und Het die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L<sup>1</sup> für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungsprodukt gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu den Verbindungen I umlagert.

- 8. Aktivierte Carbonsäuren der Formel IIIa und Carbonsäuren der Formel IIIb gemäß Anspruch 7, wobei die Substituenten  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X^1$  und Het die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und  $L^1$  für eine nucleophil austauschbare Abgangsgruppe steht.
- 9. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dions der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.
- 10. Verfahren zur Herstellung von herbizid wirksamen Mitteln gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid
  wirksame Menge mindestens eines 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dions der Formel I oder eines landwirtschaftlich
  brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6 und für
  die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.

WO 99/07688 PCT/EP98/04636

11. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 2-Benzoyl-cyclohexan-1,3-dions der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 6 auf Pflanzen, deren Lebensraum und/ oder auf Samen einwirken läßt.

12. Verwendung der 2-Benzoyl-cyclohexan·1,3-dione der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß den Ansprüchen 1 bis 6 als Herbizide.

PCT/EP 98/04636

		PC1/EP 98	7 0 4 0 3 0
A. CLASS IPC 6	ification of subject matter CO7D261/04 CO7D307/58 A01N43/8	30 A01N43/08	
According t	o International Patent Classification (IPC) or to both national classifica	ation and IPC	
	SEARCHED		
IPC 6	ocumentation searched (classification system followed by classification CO7D A01N	on symbols)	
Documenta	tion searched other than minimum documentation to the extent that si	uch documents are included in the fields so	aarched
Electronic o	data base consulted during the international search (name of data bas	se and where practical sparch terms used	10
	•		
C. DOCUM	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category -	Citation of document, with indication, where appropriate of the rele	evant passages	Relevant to claim No
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 96, no. 5, 31 May 1996 & JP 08 020554 A (HOKKO CHEM IND 23 January 1996 see abstract	1-4,9,12	
Y	EP 0 320 864 A (SCHERING AG) 21 J cited in the application see claims 1,3,4	June 1989	1-4,9,12
A	EP 0 186 120 A (STAUFFER CHEMICAL 2 July 1986 see claims 1,21,23,37	. co.)	1-4.7. 9-12
A	EP 0 186 119 A (STAUFFER CHEMICAL 2 July 1986 see claims 1,16,17,19	. co.)	1-4,7. 9-12
		-/	
X Furt	her documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family members are listed	in annex
"A" docum consist earlier filing communication which citation docum other "P" docum eater t	ent defining the general state of the lart which is not dered to be of particular relevance document but published on or after the international date.  ent which may throw doubts on priority claim(s) or is cited to establish the publication date of another in or other special reason (as specified) lent referring to an oral disclosure, use, exhibition or means.  ent published prior to the international filling date but han the priority date claimed.	"T" later document published after the interest or priority date and not in conflict with intend to understand the principle or the invention."  X" document of particular relevance, the cannot be considered novel or cannot involve an inventive step when the document of particular relevance, the cannot be considered to involve an indocument is combined with one or minents, such combination being obvious the art.  "&" document member of the same patent.  Date of mailing of the international se	the application but early underlying the claimed invention to considered to courant is taken alone claimed invention ventive step when the pre-other such docusto a person skilled family
	0 November 1998	15/12/1998	аст эроп
Name and	mailing address of the ISA  European Patent Office. P.B. 5818 Patentiaan 2  NL - 2280 HV Rijswijk  Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  Fax. (+31-70) 340-3016	Authorized officer  Hass, C	

Inte Ional Application No
PCT/EP 98/04636

·		PCT/EP 98/04636			
C.(Continu	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
ategory	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.			
Ą	EP 0 186 118 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2 July 1986 see claims 1,27,28,45	1-4,7, 9-12			
<i>t</i>	EP 0 278 742 A (MAY & BAKER LTD) 17 August 1988 cited in the application see claims 1,5-7	1-4,7, 9-12			
1	US 4 780 127 A (W. J. MICHAELY ET AL.) 25 October 1988 see claims 1,20,38	1-4,9-12			
4	US 4 954 165 A (M. BABA ET AL.) 4 September 1990 see claims 1,4,5; tables	1-4,9-12			
4	EP 0 317 158 A (ICI AMERICAS INC) 24 May 1989 see claims 1,5.6	1-4,9-12			
A	WO 91 00260 A (NIPPON SODA CO., LTD.) 10 January 1991 see claims 1,3; table 1	1-4,9,12			

Information on patent family members

Inti Ional Application No PCT/EP 98/04636

Đ,	atent document	·	· Outstand		<del></del>	98/04636
	d in search repo	rt	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP	320864	Α .	21-06-1989	DE JP US	3743695 A 2000224 A 4943310 A	29-06-1989 05-01-1990 24-07-1990
EP	186120	A	02-07-1986	AR AU AU BR CA DD DE DK FI GR JP JP US US	240909 A 586845 B 5133885 A 8506423 A 1314556 A 247211 A 3566397 A 594685 A 855048 A 853111 A 1986395 C 7013034 B 61155347 A 81731 B 4806146 A 4946981 A	27-03-1991 27-07-1989 26-06-1986 02-09-1986 16-03-1993 01-07-1987 29-12-1988 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 08-11-1995 15-02-1995 15-07-1986 18-12-1987 21-02-1989 07-08-1990
EP	186119	Α	02-07-1986	AU AU BG BR CA DD DK FI GR JP JP PT	588014 B 5133785 A 43853 A 45043 A 8506424 A 1314557 A 246991 A 594785 A 855049 A 853112 A 1979680 C 7005541 B 61152649 A 81732 B	07-09-1989 26-06-1986 15-08-1988 15-03-1989 02-09-1986 16-03-1993 24-06-1987 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 17-10-1995 25-01-1995 11-07-1986 18-12-1987
EP	186118	A	02-07-1986	AR AU AU BG BR CA CN CS DD DK FI GR HR JP PT SU US	240794 A 585917 B 5133685 A 46454 A 46452 A 8506425 A 1314558 A 1015044 B 1039799 A,B 8509551 A 247210 A 594885 A 855050 A,B 853113 A 940856 A 58400 B 1993733 C 7023347 B 61152642 A 81733 B 1715190 A 5006158 A	28-02-1991 29-06-1989 26-06-1986 15-12-1989 15-12-1989 02-09-1986 16-03-1993 11-12-1991 21-02-1990 13-10-1989 01-07-1987 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 30-06-1996 08-09-1993 22-11-1995 15-03-1995 11-07-1986 01-07-1988 23-02-1992 09-04-1991

Information on patent family members

Inte onal Application No
PCT/EP 98/04636

			<u></u>	PCT/EP	98/04636
Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 186118	A 	<b></b>	US	4946981 A	07-08-1990
EP 2787 <b>4</b> 2	A	· 17-08-1988	AU AU BG CS DD DK FI JP OA PT US	607183 B 1145488 A 6691090 A 47342 A 8800839 A 282005 A 68088 A 880591 A 63203644 A 8714 A 86750 B 5114461 A	28-02-1991 18-08-1988 27-06-1991 15-06-1990 13-06-1990 29-08-1990 12-08-1988 12-08-1988 23-08-1988 31-03-1989 30-04-1992 19-05-1992
US 4780127	A	25-10-1988	USS USS USS USS USS USS USS USS USS USS	4797150 A 4853028 A 5006158 A 4816066 A 4822906 A 4806146 A 4946981 A 560068 B 1276883 A 38931 A 8301522 A 1217204 A 236789 B 209377 A 3382601 A 131783 A,B, 0090262 A 77167 A 59474 B 1461556 C 58180451 A 63007534 B 76418 B 5006162 A 573256 B 3305284 A 43852 A 8302094 A 573256 B 3305284 A 43852 A 43852 A 43852 A 43852 A 43852 A 804629 A 1258869 A 8302094 A 573256 B 3305284 A 43852 A 43852 A 804629 A 1258869 A 804629 A 1258869 A 80346 A 940888 A 57940 B 1030818 B 1548106 C 60087238 A 79209 B	10-01-1989 01-08-1989 09-04-1991 28-03-1989 18-04-1989 21-02-1989 07-08-1990 26-03-1987 29-09-1983 14-03-1986 06-12-1983 27-01-1987 15-05-1985 09-05-1984 10-09-1992 26-09-1983 10-09-1984 09-03-1994 14-10-1988 21-10-1983 17-02-1988 13-11-1986 09-04-1991 04-02-1992 28-03-1984 02-06-1988 21-03-1985 15-08-1988 06-08-1985 29-08-1989 14-06-1995 19-02-1986 03-11-1988 17-03-1985 24-04-1985 17-01-1985 30-06-1997 19-05-1993 22-06-1989 09-03-1990 16-05-1985 22-08-1986

Information on patent family members

Inte onal Application No PCT/EP 98/04636

Patent document cited in search repo		Publication date	F	Patent family member(s)	Publication date
US 4780127	Α	<u> </u>	SK	696184 A	04-06-1997
			SU	1715189 A	23-02-1992
US 4954165	Α	04-09-1990	JP	2000222 A	05-01-1990
			JP	2739738 B	15-04-1998
			US	5094685 A	10-03-1992
EP 317158	Α	24-05-1989	US	4925965 A	15-05-1990
			JP	2256643 A	17-10-1990
WO 9100260	A	10-01-1991	AT	119146 T	15-03-1995
			CN	1048848 A,B	30-01-1991
			DE	69017383 D	06-04-1995
			DE	6 <b>901</b> 7383 T	29-06-1995
			DK	432275 T	31-07-1995
			EP	0432275 A	19-06-1991
			KR	9405913 B	24-06-1994
			LV	10074 A,B	10-05-1994
			RU	2060988 C	27-05 <b>-199</b> 6
			US	52288 <b>9</b> 8 A	20-07-1993
			CA	2035446 A	05-01-1991
			JP	32 <b>5504</b> 7 A	13-11-1991
			LT	336 A,B	25-08-1994

Inte Lionales Aktenzeichen PCT/EP 98/04636

A. KLASSI IPK 6	iFizierung des anmeldungsgegenstandes CO7D261/04 CO7D307/58 A01N43/8	0 A01N43/08	
Nach der In	rternationalen Patentklassifikation (IPK) öder nach der nationalen Klas	isitikation und der IPK	
	RCHIERTE GEBIETE	and der ii re	
Recherchie IPK 6	rter Mindestprufstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo CO7D A01N	le)	
Recherchie	rte aber nicht zum Mindestprufstoff gehörende Veröffentlichungen, so	weit diese unter die recherchierten Gebiete	fallen
	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (N	ame der Datenbank und evtl verwendete S	Suchbegriffe)
C. ALS WE	ESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN	·	
Kategorie'	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabi	e der in Betracht kommenden Teile	Betr Anspruch Nr
Y	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 96, no. 5, 31. Mai 1996 & JP 08 020554 A (HOKKO CHEM IND 23. Januar 1996 siehe Zusammenfassung	CO LTD),	1-4,9,12
Y	EP 0 320 864 A (SCHERING AG) 21. in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,3,4	Juni 1989	1-4,9,12
Α	EP 0 186 120 A (STAUFFER CHEMICAL 2. Juli 1986 siehe Ansprüche 1,21,23,37	. CO.)	1-4,7, 9-12
A	EP 0 186 119 A (STAUFFER CHEMICAL 2. Juli 1986 siehe Ansprüche 1,16,17,19	. CO.)	1-4,7, 9-12
		-/	
	tere Veroffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu nehmen	X Siehe Annang Patentfamilie	
"A" Veroffe aber r "E" alteres Anme "L" Veroffe scheil ander soll of ausge "O" Veroffe eine 6" "P" Veroffe dem t	e Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen entlichung, die den altgemeinen Stand der Technik definiert, nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist. Dokument das jedoch erst am oder nach dem internationalen iddedatum veröffentlicht worden ist entlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhalt ernen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer ren im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden der die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie stührt) entlichung, die sich auf eine mundliche Offenbarung, Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht entlichung, die vor dem internationalen Anmeidedatum, aber nach beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist.	"T" Spatere Veröffentlichung, die nach dem oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht Anmeldung nicht kollidiert, sondern nu Erfindung zugrundeliegenden Prinzips Theorie angegeben ist.  X" Veröffentlichung von besonderer Bedet kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung von besonderer Bedet kann nicht als auf erfindenscher Tätigk werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategone in diese Verbindung für einen Fachmann.  8." Veröffentlichung, die Mitglied derselber Absendedatum des internationalen Re	t worden ist und mit der ir zum Verstandnis des der oder der ihr zugrundeliegenden utung, die beanspruchte Erlindung chung nicht als neu oder auf achtet werden utung; die beanspruchte Erlindung keit berühend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und in ahallegend ist he Patentfamilie ist
	30. November 1998	15/12/1998	
Name und	Postanschrift der Internationalen Recherchenbehorde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patenttaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo.nt, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmachtigter Bediensteter  Hass, C	

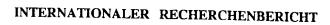
Int. .tionales Aktenzeichen
PCT/EP 98/04636

0 /5		98/04636
C.(Fortsetz Kategorie	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN  Bezeichnung der Veroffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr Anspruch Nr
	Service of the servic	Dell' Alispidell'VI
<i>†</i>	EP 0 186 118 A (STAUFFER CHEMICAL CO.) 2. Juli 1986 siehe Ansprüche 1,27,28,45	1-4,7, 9-12
	EP 0 278 742 A (MAY & BAKER LTD) 17. August 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche 1,5-7	1-4.7, 9-12
1	US 4 780 127 A (W. J. MICHAELY ET AL.) 25. Oktober 1988 siehe Ansprüche 1,20,38	1-4,9-12
١	US 4 954 165 A (M. BABA ET AL.) 4. September 1990 siehe Ansprüche 1,4,5; Tabellen	1-4,9-12
1	EP 0 317 158 A (ICI AMERICAS INC) 24. Mai 1989 siehe Ansprüche 1,5,6	1-4,9-12
4	WO 91 00260 A (NIPPON SODA CO., LTD.) 10. Januar 1991 siehe Ansprüche 1,3; Tabelle 1 	1-4,9,12

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur seiben Patentfamilie gehören

Inte onales Aktenzeichen
PCT/EP 98/04636

				PCT/EP 98/04636			
	Recherchenberich nites Patentdoku		Datum der Veroffentlichung		ed(er) der ntfamilie	Datum der Veroffentlichung	
EP	320864	A	21-06-1989	JP	3743695 A 2000224 A 4943310 A	29-06-1989 05-01-1990 24-07-1990	
EP	186120	А	02-07-1986	BR CA DD DE DK FI GR JP JP JP FT US	240909 A 586845 B 5133885 A 8506423 A 1314556 A 247211 A 3566397 A 594685 A 855048 A 853111 A 1986395 C 7013034 B 1155347 A 81731 B 4806146 A 4946981 A	27-03-1991 27-07-1989 26-06-1986 02-09-1986 16-03-1993 01-07-1987 29-12-1988 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 08-11-1995 15-02-1995 15-07-1986 18-12-1987 21-02-1989 07-08-1990	
EP	186119	A	02-07-1986	BG BR CA DD DK FI GR JP JP	588014 B 5133785 A 43853 A 45043 A 8506424 A 1314557 A 246991 A 594785 A 855049 A 853112 A 1979680 C 7005541 B 1152649 A 81732 B	07-09-1989 26-06-1986 15-08-1988 15-03-1989 02-09-1986 16-03-1993 24-06-1987 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 17-10-1995 25-01-1995 11-07-1986 18-12-1987	
EP	186118	A	02-07-1986	BG BR CA CN CS DD DK FI GR HR IE JP JP	240794 A 585917 B 5133685 A 46454 A 46452 A 8506425 A 1314558 A 1015044 B 1039799 A,B 8509551 A 247210 A 594885 A 855050 A,B 853113 A 940856 A 58400 B 1993733 C 7023347 B 61152642 A 81733 B 1715190 A 5006158 A	28-02-1991 29-06-1989 26-06-1986 15-12-1989 15-12-1989 02-09-1986 16-03-1993 11-12-1991 21-02-1990 13-10-1989 01-07-1987 21-06-1986 21-06-1986 22-04-1986 30-06-1996 08-09-1993 22-11-1995 15-03-1995 11-07-1986 01-07-1988 23-02-1992 09-04-1991	



Angaben zu Veröffentlichungen, die zur seiben Patentfamilie gehören

Inte phajes Aktenzeichen
PCT/EP 98/04636

Wigdom 23 Veromenti	A igaceri zu verörtertlichungen, die zur seiben Hatenmamilie genoren			PC	T/EP	98/04636
Im Recherchenberich angeführtes Patentdokui		Datum der Veröffentlichung		lied(er) der entfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 186118	Α		US	4946981	A	07-08-1990
EP 278742	Α	17-08-1988	AU AU BG CS DD DK FI JP OA PT US	607183 1145488 6691090 47342 8800839 282005 68088 880591 63203644 8714 86750 5114461	A A A A A A A A B	28-02-1991 18-08-1988 27-06-1991 15-06-1990 13-06-1990 29-08-1990 12-08-1988 12-08-1988 23-08-1988 31-03-1989 30-04-1992 19-05-1992
US 4780127	A	25-10-1988	JP PT US ZAU AU BG BR CZ DD DE HR IE JP JP	4797150 4853028 5006158 4816066 4822906 4806146 4946981 560068 1276883 38931 8301522 1217204 236789 209377 3382601 131783 0090262 77167 59474 1461556 58180451 63007534 76418 5006162 5085688 8302094 573256 3305284 43852 8404629 1258869 8406961 233150 3474297 439484 0137963 80346 940888 57940 1030818 1548106 60087238 79209	A A A A A A B A A A A A A A A A A A A A	10-01-1989 01-08-1989 09-04-1991 28-03-1989 18-04-1989 21-02-1989 07-08-1990 26-03-1987 29-09-1983 14-03-1986 06-12-1983 27-01-1987 15-05-1985 09-05-1984 10-09-1992 26-09-1983 05-10-1983 10-09-1984 09-03-1994 14-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-10-1988 21-03-1986 09-04-1991 04-02-1992 28-03-1986 03-11-1988 29-08-1989 14-06-1995 19-02-1986 03-11-1988 17-03-1985 24-04-1985 17-01-1985 30-06-1997 19-05-1993 22-06-1989 09-03-1990 16-05-1985 22-08-1986

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehoren

Inte ionales Aktenzeichen
PCT/EP 98/04636

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		iglied(er) der atentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 4780127	А		SK SU	696184 A 1715189 A	04-06-1997 23-02-1992
US 4954165	A	04-09-1990	JP JP US	2000222 A 2739738 B 5094685 A	05-01-1990 15-04-1998 10-03-1992
EP 317158	Α	24-05-1989	US JP	4925965 A 2256643 A	15-05-1990 17-10-1990
WO 9100260	A	10-01-1991	AT CN DE DK EP KR LV RU US CA JP LT	119146 T 1048848 A,B 69017383 D 69017383 T 432275 T 0432275 A 9405913 B 10074 A,B 2060988 C 5228898 A 2035446 A 3255047 A 336 A,B	15-03-1995 30-01-1991 06-04-1995 29-06-1995 31-07-1995 19-06-1991 24-06-1994 10-05-1994 27-05-1996 20-07-1993 05-01-1991 13-11-1991 25-08-1994